

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2004 年 10 月 7 日 (07.10.2004)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2004/085382 A1

(51) 国際特許分類: C07C 251/80, 251/86, 317/44, 323/25, 323/60, 323/66, C07D 207/18, 211/46, 211/58, 211/60, 213/32, 213/44, 213/81, 231/04, 241/04, 243/08, 261/18, 249/12, 257/04, 295/08, 295/12, 295/18, 307/68, 307/52, 333/38, 403/12, 405/12, 409/12, 491/10

[JP/JP]; 〒1048288 東京都中央区新川二丁目 10 番 1 号 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/004427

(22) 国際出願日: 2004 年 3 月 29 日 (29.03.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-089173 2003 年 3 月 27 日 (27.03.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 麒麟麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA)

(72) 発明者; および

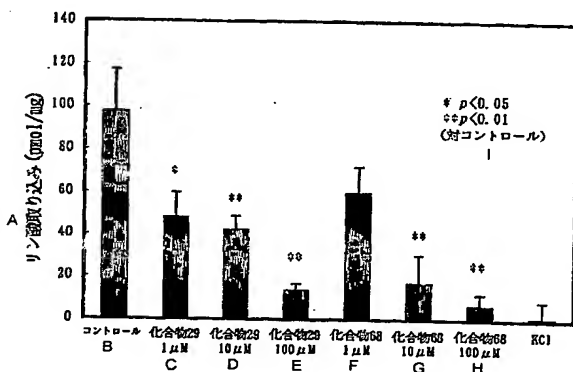
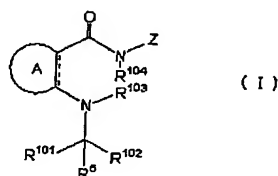
(75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): 江藤 伸晃 (ETO, Nobuaki) [JP/JP]; 〒3701295 群馬県高崎市宮原町 3 番地 麒麟麦酒株式会社 医薬探索研究所内 Gunma (JP). 長尾 里佳 (NAGAO, Rika) [JP/JP]; 〒3701295 群馬県高崎市宮原町 3 番地 麒麟麦酒株式会社 医薬探索研究所内 Gunma (JP). 宮崎 哲子 (MIYAZAKI, Tetsuko) [JP/JP]; 〒3701295 群馬県高崎市宮原町 3 番地 麒麟麦酒株式会社 医薬探索研究所内 Gunma (JP).

(74) 代理人: 吉武 賢次, 外 (YOSHITAKE, Kenji et al.); 〒1000005 東京都千代田区丸の内三丁目 2 番 3 号 富士ビル 3 2 3 号 協和特許法律事務所 Tokyo (JP).

[続葉有]

(54) Title: COMPOUND INHIBITING IN VIVO PHOSPHORUS TRANSPORT AND MEDICINE CONTAINING THE SAME

(54) 発明の名称: 生体内リン輸送を阻害する化合物およびそれを含んでなる医薬



A... INCORPORATION OF PHOSPHORIC ACID (pmol/mg)  
B... CONTROL  
C... COMPOUND 29 1 μM  
D... COMPOUND 29 10 μM  
E... COMPOUND 29 100 μM  
F... COMPOUND 68 1 μM  
G... COMPOUND 68 10 μM  
H... COMPOUND 68 100 μM  
I... (BASED ON CONTROL)

(57) Abstract: A compound which effectively lowers the phosphorus concentration in blood serum and hence can effectively prevent or cure diseases caused by an increase in the phosphorus concentration in blood serum. It is a compound represented by the formula (I), a pharmaceutically acceptable salt thereof, or a solvate thereof. (In the formula, A represents an optionally substituted, 5- to 9-membered, unsaturated carbocycle part or 5- to 9-membered, unsaturated heterocycle part; --- represents a single bond or double bond; R<sup>5</sup> represents optionally substituted aryl, etc.; Z represents -N=CHR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>, etc.; R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> each represents hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl, etc.; and R<sup>101</sup> and R<sup>102</sup> in combination represent =O and R<sup>103</sup> and R<sup>104</sup> each represents hydrogen, or R<sup>101</sup> and R<sup>104</sup> in combination represent a bond and R<sup>102</sup> and R<sup>103</sup> in combination represent a bond.)

[続葉有]



(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

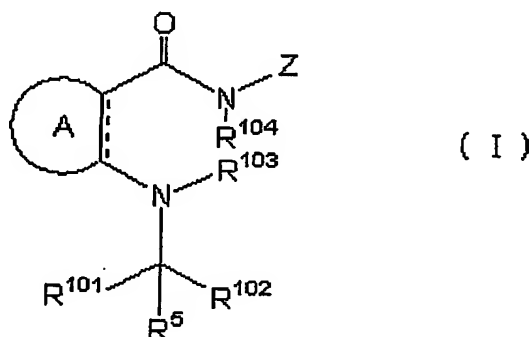
- 国際調査報告書
- 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG,

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

本発明は、血清中のリン濃度を効果的に抑制することにより、血清中のリン酸濃度の上昇により生ずる疾患を効果的に予防または治療できる化合物を提供することをその目的とする。本発明による化合物は、式 (I) の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物である。



(式中、Aは置換されていてもよい5～9員の不飽和の炭素環部分または5～9員の不飽和の複素環部分を表し、---は単結合または二重結合を表し、R<sup>5</sup>は、置換されていてもよいアリール基等を表し、Zは-N=CHR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>等を表し、R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は、H、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアリール基等を表し、R<sup>101</sup>とR<sup>102</sup>が一緒になって=Oを表し、かつR<sup>103</sup>およびR<sup>104</sup>がHを表すか、あるいはR<sup>101</sup>とR<sup>104</sup>が一緒になって結合を表し、かつR<sup>102</sup>とR<sup>103</sup>とが一緒になって結合を表す。)



決していえない。

現在まで使用されてきた高リン血症治療薬はいずれも上記のような弊害を有するにもかかわらず、これらを解決する高リン血症治療薬はこれまで知られていない。

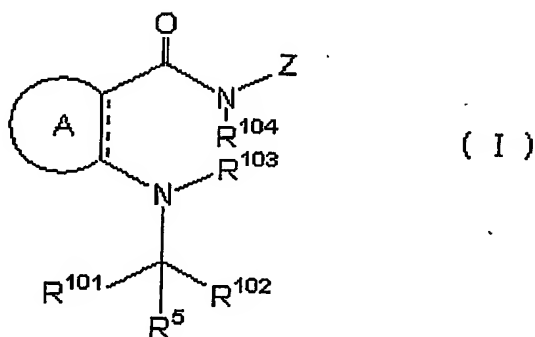
高リン血症治療薬は、例えば、WO 98 / 03185 号公報や腎と骨代謝 Vol. 15, No. 1 pp75-80 (2002) に開示されている。

### 発明の概要

本発明者らは今般、ウサギ小腸上皮細胞刷子縁膜小胞（以下「ウサギBBMV」という）内へのナトリウム依存性リン酸輸送を阻害し、腎臓および小腸に存在するナトリウム依存性リン酸吸収担体（NaPi-2a および NaPi-2b）を細胞膜に発現するアフリカツメガエル卵母細胞内へのナトリウム依存性のリン酸の取り込みを阻害する化合物を見出した。本発明者等はまた、ヒドラジン骨格を有する化合物が放射性同位体元素である $^{32}\text{P}$ を含有する食餌を経口投与された正常ラットの血中放射活性を低下させたことを見出した。

本発明は、従来と異なる機構により血清中のリン濃度を効果的に抑制することにより、血清中のリン酸濃度の上昇により生ずる疾患を効果的に予防または治療できる化合物および医薬組成物の提供をその目的とする。

本発明による化合物は、式（I）の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物である。



（上記式中、

Aは、5～9員の不飽和の炭素環部分または5～9員の不飽和の複素環部分を

表し、—は単結合または二重結合を表し、

Aが表す炭素環部分および複素環部分は

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c)  $C_{1-6}$ アルキル基；
- (d)  $C_{1-6}$ アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；
- (k) モノーまたはジ-アリールアミノ基；
- (l) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基；
- (m)  $C_{2-6}$ アルケニル基；
- (n)  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基；
- (o)  $C_{2-6}$ アルケニルチオ基；
- (p) モノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基；
- (q) カルボキシル基；または
- (r)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-オキシカルボニル基；

により置換されていてもよく、

(c)  $C_{1-6}$ アルキル基、(d)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、(h) アルキルチオ基、(m)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(n)  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、および(o)  $C_{2-6}$ アルケニルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)

アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、(14)アリールアミノ基(このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい)、(15) $C_{1-6}$ アルコキシ $(CH_2CH_2O)_m$ 基(ここで、 $m$ は1~6の整数を表す)、(16)カルボキシル基、(17)酸素原子( $=O$ )、または(18) $C_{3-7}$ シクロアルキル基により置換されていてもよく、

(k) モノーまたはジーアリールアミノ基においてアリール部分は更に、(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5) $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6) $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジー $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでもよい)、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、(14)アリールアミノ基(このアミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい)、(15) $C_{1-6}$ アルコキシ $(CH_2CH_2O)_m$ 基(ここで $m$ は1~6の整数を表す)、(16)カルボキシル基、(17)酸素原子( $=O$ )、または(18) $C_{3-7}$ シクロアルキル基により置換されていてもよく、モノアリールアミノ基の場合アミノ基は更に、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)によって置換されていてもよく、

(1) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$ アルキル基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$ アルキル( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基(アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基(複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換

される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成してもよい)； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の1または2つの $C_{1-6}$ アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)；アリールアミノ基(アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい)；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい)；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子；水酸基；カルボキシル基； $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基； $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基；アリール基(このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい)；酸素原子(=O)；または複素環式基により更に置換されていてもよく、

(p)モノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基において、モノアルケニルアミノ基の場合アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)によって置換されていてもよく、ジ- $C_{2-6}$ アルケニル基は一緒になって不飽和環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルケニル基もしくは不飽和環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$ アルキル( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基(アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基(複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成してもよい)； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$

アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の1または2つの $C_{1-6}$ アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)；アリールアミノ基(アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい)；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい)；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子；水酸基；カルボキシル基； $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基； $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基；アリール基(このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい)；酸素原子(=O)；または複素環式基により更に置換されていてもよく、

Aが表す炭素環部分および複素環部分が2つの(c)  $C_{1-6}$ アルキル基または(m)  $C_{2-6}$ アルケニル基により置換されている場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

$R^5$ は、 $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、または複素環式基を表し、 $R^5$ が表す $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、または複素環式基は、同一または異なっているとしてもよく、下記基：

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、(8')複素環式基により置換されたアミノ基(この複素環式基は更に $C_{1-6}$ アルキル基によ

り置換されていてもよい)、(9)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$  アルキルまたはアリールスルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$  アルキルまたはアリールウレイド基、(19)  $C_{1-6}$  アルコキシまたはアリールオキシカルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$  アルキルアミノまたはアリールアミノカルボニルオキシ基、(21) カルボキシ基、(22) ニトロ基、(23) 複素環式基、(23')  $Het-S(=O)_j-$  ( $Het$  は複素環式基を表し、 $j$  は 0、1、または 2 を表し、 $Het$  はモノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい)、(24) シアノ基、および(25) ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基

(ここで、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、および(7)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基のアルキル部分は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、モノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシ基、 $-S(=O)_2(-OH)$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシまたはアリールオキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基

(この複素環式基はモノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$ アルキル（ $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基（アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）、複素環式基（複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成していてもよい）； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子(=O)；水酸基；カルボキシル基； $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基； $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基；アリール基（このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい）；または複素環式基（好ましくは、5~7員飽和または不飽和複素環、より好ましくは、ピリジル、ピリミジル、ピリダジル）により更に置換されていてもよく、環状アミノ部分の一つの炭素原子が同一または異なってもよい二つの $C_{1-6}$ アルコキシ基により置換されているとき、この二つのアルコキシ基は一緒になって基- $O-(CH_2)_p-O-$ （ここでpは2~4の整数を表す）を形成してもよく、環状アミノ基は単環性または二環性の芳香族炭素環（好ましくは、フェニル、ナフチル）または単環性または二環性の

芳香族複素環（好ましくは、ピリジル、ナフチリジル）と縮合して二環性または三環性複素環式基を表すことができる。）；

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基；

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルチオ基；

(V)  $C_{3-7}$  シクロアルキル基；

(VI) アリール基；

(VII) アリールオキシ基；

(VIII)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基；

(VIX)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基；

(X) 水酸基；

(XI) ニトロ基；

(XII) シアノ基；

(XIII) アミノ基；

(XIV) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよい）；

(XV) アリールアミノ基；

(XVI)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基；

(XVII)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-ウレイド基；

(XVIII)  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基；

(XIX)  $C_{1-6}$  アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基；

(XX)  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基；

(XXI) アシル基；

(XXII) カルボキシル基；

(XXIII) カルバモイル基；

(XXIV) モノーまたはジ-アルキルカルバモイル基；

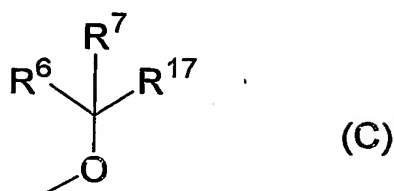
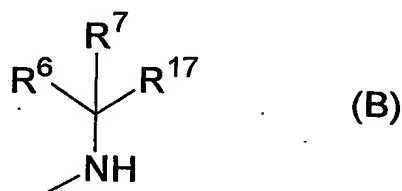
(XXV) 複素環式基；

(XXVI) アルキル-またはアリール-スルホニル基；

(XXVII)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基；または



(XXVIII)  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基  
 により置換されていてもよく、  
 Zは基(A)、基(B)、または基(C)



を表し、

ここで、 $R^6$ および $R^7$ は、同一または異なってもよく、水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、アリール基、アリール $C_{1-6}$ アルキル基、アリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または複素環式基を表し、 $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、アリール $C_{1-6}$ アルキル基、アリール $C_{2-6}$ アルケニル基、および複素環式基は、同一または異なってもよく、下記基：

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)水酸基により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6) $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7) $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8)モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい）、(9) $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、(10) $C_{1-6}$ アルキルカルボニルチオ基、(11) $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)ア

リールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールスルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールウレイド基、(19)  $C_{1-6}$ アルコキシまたはアリールオキシカルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$ アルキルアミノまたはアリールアミノカルボニルオキシ基、(21)カルボキシ基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')  $Het-S-$  ( $Het$ は複素環式基を表す)、(24)シアノ基、(25)ハロゲン原子、および(26)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールオキシカルボニル基からなる群から選択される置換基を有していてもよい  $C_{1-6}$ アルキル基；

(III) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)水酸基により置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、(9)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールスルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールウレイド基、(19)  $C_{1-6}$ アルコキシまたはアリールオキシカルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$ アルキルアミノまたはアリールアミノカルボニルオキシ基、(21)カルボキシ基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')  $Het-S-$  ( $Het$ は複素環式基を表す)、(24)シアノ基、(25)ハロゲン原子、および(26)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールオキシカルボニル基からなる群から選択される置換基を有していてもよい  $C_{1-6}$ アルコキシ基；

(IV)ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキルチオ基；

(V)  $C_{3-7}$ シクロアルキル基；

(VI)アリール基；

(VII)アリールオキシ基；

(VIII)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基；

(VIX)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基 ;

(X) 水酸基 ;

(XI) ニトロ基 ;

(XII) シアノ基 ;

(XIII) アミノ基 ;

(XIV) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよい) ;

(XV) アリールアミノ基 ;

(XVI)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基 ;

(XVII)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-ウレイド基 ;

(XVIII)  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基 ;

(XIX)  $C_{1-6}$  アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基 ;

(XX)  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基 ;

(XXI) アシル基 ;

(XXII) カルボキシル基 ;

(XXIII) カルバモイル基 ;

(XXIV) モノーまたはジ-アルキルカルバモイル基 ;

(XXV) 複素環式基 ;

(XXVI) アルキル-またはアリール-スルホニル基 ; または

(XXVII)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基 ; または

(XXVIII)  $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基

により置換されていてもよく、

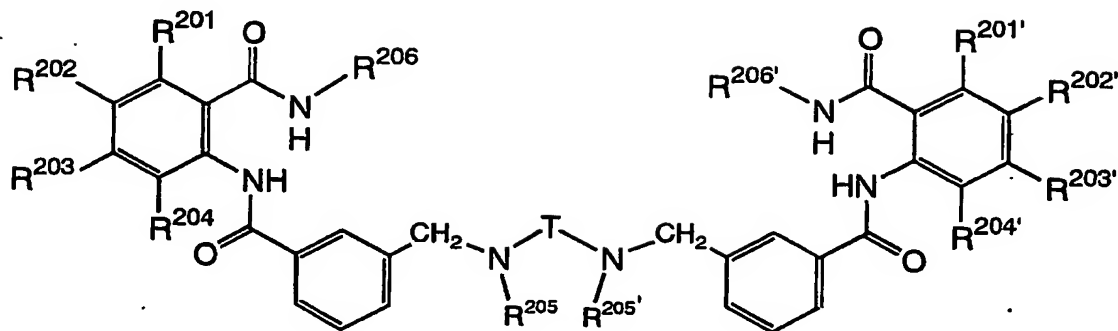
$R^{17}$  は水素原子を表し、

$R^{101}$  と  $R^{102}$  が一緒になって  $=O$  を表し、かつ  $R^{103}$  および  $R^{104}$  が水素原子を表すか、あるいは

$R^{101}$  と  $R^{104}$  が一緒になって結合を表し、かつ  $R^{102}$  と  $R^{103}$  とが一緒になって結合を表す。) )

本発明による化合物はまた、式 (I-3) の化合物およびその薬学上許容され

る塩および溶媒和物である。

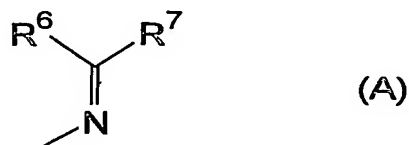


(I-3)

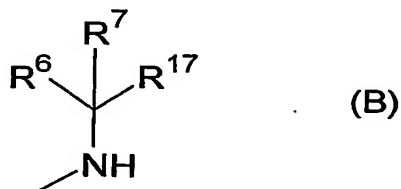
(上記式中、 $R^{201}$ 、 $R^{202}$ 、 $R^{203}$ 、 $R^{204}$ 、 $R^{201'}$ 、 $R^{202'}$ 、 $R^{203'}$ 、および $R^{204'}$ は、同一または異なっているもよく、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、 $C_{1-6}$ アルキル基、または $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、

$R^{205}$ および $R^{205'}$ は、同一または異なっているもよく、水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^{206}$ および $R^{206'}$ は、同一または異なっているもよく、基Aまたは基B



(A)



(B)

(上記式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ がアリール基または飽和または不飽和の5または6員複素環式基（アリール基および複素環式基はハロゲン原子またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表す）

を表し、

TはC<sub>2-8</sub>アルキレン鎖を表す)

本発明による医薬組成物は本発明による化合物を含んでなるもの、である。

本発明による医薬組成物は、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療に用いることができる。本発明による化合物はまた、血清リン濃度低下剤およびリン酸輸送阻害剤として用いることができる。

本発明によれば、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療用医薬の製造のための、本発明による化合物の使用が提供される。

本発明によれば、血清リン濃度低下剤の製造のための、本発明による化合物の使用が提供される。

本発明によれば、リン酸輸送阻害剤の製造のための、本発明による化合物の使用が提供される。

本発明によれば、本発明による化合物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与することを含んでなる、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療方法が提供される。

本発明によれば、本発明による化合物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、血流中の血清リン濃度を低下させる方法が提供される。

本発明によれば、本発明による化合物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、生体内におけるリン酸輸送を阻害する方法が提供される。

#### 図面の簡単な説明

図1は、本発明による化合物によるウサギ空腸刷子縁膜小胞のナトリウム依存性リン酸取り込みの阻害を示した図である。

図2は、本発明による化合物によるウサギ空腸刷子縁膜小胞のナトリウム依存性グルコース取り込みの阻害を示した図である。

図3は、本発明による化合物によるNaPi-2aを発現させたアフリカツメ

ガエル卵母細胞のナトリウム依存性リン酸取り込みの阻害を示した図である。

図4は、本発明による化合物によるNaPi-2aおよびNaPi-2bを発現させたアフリカツメガエル卵母細胞のナトリウム依存性リン酸取り込みの阻害を示した図である。

## 発明の具体的説明

### 化合物

本明細書において、基または基の一部としての「C<sub>1-6</sub>アルキル」および「C<sub>1-6</sub>アルコキシ」という語は、基が直鎖または分岐鎖の炭素数1～6のアルキル基およびアルコキシ基を意味する。「C<sub>1-6</sub>アルキル」および「C<sub>1-6</sub>アルコキシ」は、好ましくは、C<sub>1-4</sub>アルキルおよびC<sub>1-4</sub>アルコキシであることができる。

本明細書において、基または基の一部としての「C<sub>3-7</sub>シクロアルキル」という語は、基が環状の炭素数3～7のアルキル基を意味する。「C<sub>3-7</sub>シクロアルキル」は、好ましくは、C<sub>5-7</sub>シクロアルキルであることができる。

本明細書において、基または基の一部としての「C<sub>2-6</sub>アルケニル」および「C<sub>2-6</sub>アルキニル」という語は、基が直鎖または分岐鎖の炭素数2～6のアルケニル基および炭素数2～6のアルキニル基を意味する。「C<sub>2-6</sub>アルケニル」は、好ましくは、C<sub>2-4</sub>アルケニルであることができる。「C<sub>2-6</sub>アルキニル」は、好ましくは、C<sub>2-4</sub>アルキニルであることができる。

C<sub>1-6</sub>アルキルの例としては、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシルが挙げられる。

C<sub>1-6</sub>アルコキシの例としては、メトキシ、エトキシ、n-プロポキシ、i-プロポキシ、n-ブトキシ、i-ブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシが挙げられる。

C<sub>3-7</sub>シクロアルキルの例としては、シクロプロピル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基が挙げられる。

C<sub>2-6</sub>アルケニルの例としては、アリル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキ

セニル基が挙げられる。

$C_{2-6}$ アルキニルの例としては、2-プロピニル基、ブチニル基、ペンチニル基、ヘキシニル基が挙げられる。

本明細書において、「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、およびヨウ素原子を意味する。

本明細書において、「不飽和の炭素環」および「不飽和の複素環」とは、二重結合等の不飽和結合を1以上有する炭素環および複素環を意味する。

本明細書において、「アリール基」とは、単環性、二環性、または三環性の芳香族炭化水素基を意味する。アリール基の例としては、フェニル基、ナフチル基、アントリル基が挙げられる。

本明細書において、「アリール $C_{1-6}$ アルキル基」とは、単環性、二環性、または三環性の芳香族炭化水素基により置換された $C_{1-6}$ アルキル基を意味する。アリール $C_{1-6}$ アルキル基の例としては、ベンジル基( $C_6H_5CH_2-$ )、フェネチル基( $C_6H_5CH_2CH_2-$ )が挙げられる。

本明細書において、「アリールアミノ基」とは、単環性、二環性、または三環性の芳香族炭化水素基により置換されたアミノ基を意味する。

本明細書において、「アリール $C_{2-6}$ アルケニル基」とは、単環性、二環性、または三環性の芳香族炭化水素基により置換された $C_{2-6}$ アルケニル基を意味する。アリール $C_{2-6}$ アルケニル基の例としては、フェニルエテニル基( $C_6H_5-CH=CH-$ )が挙げられる。

本明細書において、「複素環式基」とは、飽和または不飽和の5～9員（好ましくは5～7員、より好ましくは5または6員）の単環性複素環式基および飽和または不飽和の9～11員二環性複素環式基を意味する。複素環式基は、酸素原子、窒素原子、および硫黄原子から選択される異種原子を一個以上含む。複素環の例としては、ピリジル、フリル、チエニル、ピロリル、ピリダジル、ピリミジル、ピラジル、イソキサゾリル、キノリル、キノキサリニル、およびキナゾリジルが挙げられる。

本明細書において、ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は、窒素原子に結合する二つの $C_{1-6}$ アルキル基が一緒になって「環状アミノ基」を形成してもよい。「環状

アミノ基」とは、窒素原子に結合する二つの $C_{1-6}$ アルキル基が一緒になって形成された飽和の5-8員複素環式基を意味する。環状アミノ基は、アミノ基の窒素原子以外に1-3個の異種原子（好ましくは、1個の酸素原子、1個の窒素原子、または1個の硫黄原子）を含んでいてもよい。飽和の環状アミノ基の例としては、ピロリジル、ピペリジル、ピペラジル、モルホルル、チオモルホルル、ホモピペリジル、および[1, 4]ジアゼピンが挙げられる。

本明細書において、ジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は、窒素原子に結合する二つの $C_{2-6}$ アルケニル基が一緒になって「不飽和環状アミノ基」を形成してもよい。「環状アミノ基」とは、窒素原子に結合する二つの $C_{2-6}$ アルケニル基が一緒になって形成された不飽和の5-8員複素環式基を意味する。環状アミノ基は、アミノ基の窒素原子以外に1-3個の異種原子（好ましくは、1個の酸素原子または1個の窒素原子）を含んでいてもよい。不飽和の環状アミノ基の例としてはピロール基、ピラゾール基、イミダゾリル基、テトラヒドロピリジル基が挙げられる。

式(I)にはヒドラジン誘導体とキナゾロン誘導体が含まれている。 $R^{101}$ と $R^{102}$ が一緒になって $=O$ を表し、かつ $R^{103}$ および $R^{104}$ が水素原子を表す場合には式(I)はヒドラジン誘導体を表し、 $R^{101}$ と $R^{104}$ が一緒になって結合を表し、かつ $R^{102}$ と $R^{103}$ とが一緒になって結合を表す場合には式(I)はキナゾロン誘導体を表す。

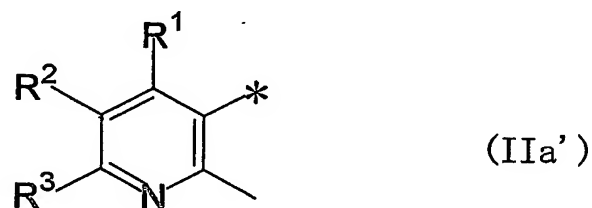
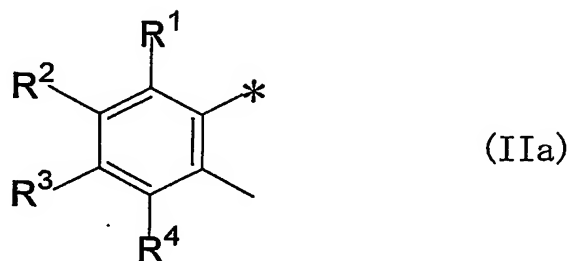
式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において、Aが表す5-9員の不飽和の炭素環部分または5-9員の不飽和の複素環部分は、例えば、ベンゼン環部分、シクロヘキセン環部分、またはピリジン環部分を表すことができる。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において、Aが表す炭素環部分および複素環部分が2つの(c)  $C_{1-6}$ アルキル基または(m)  $C_{2-6}$ アルケニル基により置換されている場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基は一緒になって $C_{3-5}$ アルキレン鎖または $C_{3-5}$ アルキレン鎖を形成してもよい。この場合、Aは、例えば、ナフチル基、キノリル基、ベンゾ[b]チオフェン、4, 5, 6, 7, -テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン、シクロペンタ



[b] チオフェン、キナゾリルを表すことができる。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、A が表す 5～9 員の不飽和の炭素環部分または 5～9 員の不飽和の複素環部分は、好ましくは、式 (IIa) または式 (IIa') を表すことができる。



(上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および  $R^4$  は、同一または異なっているとしてもよく、

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c)  $C_{1-6}$  アルキル基；
- (d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；
- (k) モノーまたはジ-アリールアミノ基；
- (l) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基；

- (m)  $C_{2-6}$  アルケニル基；
- (n)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基；
- (o)  $C_{2-6}$  アルケニルチオ基；または
- (p) モノーまたはジ- $C_{2-6}$  アルケニルアミノ基；
- (q) カルボキシル基；
- (r)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-オキシカルボニル基；または
- (s) 水素原子

を表し、

(c)  $C_{1-6}$  アルキル基、(d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、(h) アルキルチオ基、(m)  $C_{2-6}$  アルケニル基、(n)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、および(o)  $C_{2-6}$  アルケニルチオ基は、更に(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または(14) アリールアミノ基(このアミノ基は更に $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい)(15)  $C_{1-6}$  アルコキシ- $(CH_2CH_2O)_m$  基(ここで、 $m$ は1～6の整数を表す)、(16) カルボキシル基、(17) 酸素原子( $=O$ )、または(18)  $C_{3-7}$  シクロアルキル基により置換されていてもよく、

(k) モノーまたはジ-アリールアミノ基においてアリール部分は更に、(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、(14) アリールアミノ基(このアミノ基はさら

に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい)、(15)  $C_{1-6}$  アルコキシ- $(CH_2CH_2O)_m$  基(ここで  $m$  は 1~6 の整数を表す)、(16) カルボキシル基、(17) 酸素原子( $=O$ )、または(18)  $C_{3-7}$  シクロアルキル基により置換されていてもよく、モノアリールアミノ基の場合アミノ基は更に、 $C_{1-6}$  アルキル基( $C_{1-6}$  アルキル基は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)によって置換されていてもよく、

(1) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$  アルキル基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$  アルキル( $C_{1-6}$  アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基(アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基(複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分が 2 つの  $C_{1-6}$  アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって  $C_{3-7}$  シクロアルキル基を形成してもよい)； $C_{1-6}$  アルコキシ基； $C_{1-6}$  アルキルチオ；モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の 1 または 2 つの  $C_{1-6}$  アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)；アリールアミノ基(アミノ基はさらに  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよい)；モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい)；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子( $=O$ )；水酸基；カルボキシル基； $C_{1-6}$  アルコキシまたはアリールオキシカルボニル基； $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基；アリール基(このアリール基

はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基により更に置換されていてもよく、

(p) モノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基において、モノアルケニルアミノ基の場合アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)によって置換されていてもよく、ジ- $C_{2-6}$ アルケニル基は一緒になって不飽和環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルケニル基もしくは不飽和環状アミノ部分は、ハロゲン原子 ;  $C_{1-6}$ アルキル( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基(アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基(複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成してもよい) ;  $C_{1-6}$ アルコキシ基 ;  $C_{1-6}$ アルキルチオ ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の1または2つの $C_{1-6}$ アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい) ; アリールアミノ基(アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい) ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールオキシ基 ; アリールチオ基 ; 酸素原子(=O) ; 水酸基 ; カルボキシル基 ;  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基 ;  $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基 ; アリール基(このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基により更に置換されていてもよく、

Aが表す炭素環部分および複素環部分が2つの(c)  $C_{1-6}$ アルキル基または(m)  $C_{2-6}$ アルケニル基により置換されている場合（好ましくは、 $R^2$ および $R^3$ の位置が置換されている場合）には、これらのアルキル基またはアルケニル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

\*は $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$ との結合を表す。）

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において、Aは式(IIa)を表すことができ、この場合、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、好ましくは、

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c)  $C_{1-6}$ アルキル基；
- (d)  $C_{1-6}$ アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；または
- (k) 水素原子

を表し、

(c)  $C_{1-6}$ アルキル基、(d)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、および(h) アルキルチオ基は、更に(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または(14) アリールアミノ基（このアミノ

基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (Ia) または式 (IIa') を表す場合には、好ましくは、 $R^1$ 、 $R^3$ 、および  $R^4$  は、同一または異なっているとしてもよく、

水素原子；

ハロゲン原子；

$C_{1-6}$  アルキル基 (このアルキル基は、 $C_{1-6}$  アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；

アリール基 (このアリール基は、 $C_{1-6}$  アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；

$C_{1-6}$  アルコキシ基 (このアルコキシ基は、 $C_{1-6}$  アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ；または

アリールオキシ基 (このアリールオキシ基は、 $C_{1-6}$  アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい)

を表し、

$R^2$  は

水素原子；

ハロゲン原子；

水酸基；

$C_{1-6}$  アルキル基 (このアルキル基は、(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) 、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または (14) アリールアミノ基 (このアミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_1$

-<sub>6</sub>アルコキシ基、またはC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基により置換されていてもよい)により置換されていてもよい) ; または

C<sub>1-6</sub>アルコキシ基 (このアルコキシ基は、(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、(5)C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基、(6)C<sub>1-6</sub>アルキルスルホニル基、(7)モノまたはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基 (ジ-C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子により置換されていてもよい)

を表すことができ、より好ましくは、

R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、およびR<sup>4</sup>は水素原子を表し、

R<sup>2</sup>は

ハロゲン原子 ;

水酸基 ;

モノまたはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基により置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基 ; または

モノまたはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基により置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基

を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) においてAが式 (II a) または式 (II a') を表す場合には、好ましくは、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、およびR<sup>4</sup>が、同一または異なっているとしてもよく、水素原子 ; ハロゲン原子 ; 水酸基 ; 置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基 ; 置換基を有してもよいC<sub>2-6</sub>アルケニル基 ; 置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基 ; 置換基を有してもよいモノーまたはジ-アリールアミノ基 ; 置換基を有してもよいモノーまたはジ-C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基 (ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) ; 置換基を有してもよいモノーまたはジ-C<sub>2-6</sub>アルケニルアミノ基 (ジC<sub>2-6</sub>アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミ

ノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表し、 $R^2$ および $R^3$ が置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基または置換基を有してもよい $C_{2-6}$ アルケニル基である場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基は $R^2$ および $R^3$ が結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、より好ましくは $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(II a)または式(II a')を表す場合には、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、好ましくは、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すことができ、より好ましくは $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(II a)または式(II a')を表す場合には、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、より好ましくは、水素原子を表すことができる。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(II a)または式(II a')を表す場合には、より好ましくは、

$R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、

$R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が(好ましくは、 $R^2$ が)ハロゲン原子；水酸基；置換基(好ましくは、ハロゲン原子、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジアルキルアミノ基、水酸基)を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基(好ましくは、ハロゲン原子、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジアルキルアミノ基、水酸基、 $C_{1-6}$ アルコキシ $-(CH_2CH_2O)_m$ 基(ここで、 $m$ は1～6の整数を表す)、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基)を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジリアルールアミノ基；置換基(好ましくは、水酸基、水酸基により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、酸素原子(=O)、環状アミノ基を形成してもよいモノーまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、カルボキシル基)を有してもよいモノーまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基(好ましくは、水酸基、水酸基により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、酸素原子(=O)、環状



アミノ基を形成してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、カルボキシル基)を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基(ジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表し、他方が(好ましくは、 $R^3$ が)水素原子を表す。

上記の好ましい場合において、環状アミノ基はより好ましくは、アミノ基の窒素原子以外に1個の酸素原子、1個の窒素原子、または1個の硫黄原子を含んでいてもよい、5～7員の複素環式基であることができ、特に好ましい飽和の環状アミノ基としては、ピロリジル、ピペリジル、ピペラジル、モルホルル、チオモルホルル、ホモピペリジル、[1, 4]ジアゼピンが挙げられる。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(IIa)または式(IIa')を表す場合には、より好ましくは、 $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表すことができる。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(IIa)または式(IIa')を表す場合には、より好ましくは、 $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基(好ましくは、ハロゲン原子、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ-アルキルアミノ基、水酸基)を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基(好ましくは、ハロゲン原子、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ-アルキルアミノ基、水酸基、 $C_{1-6}$ アルコキシ- $(CH_2CH_2O)_m$ 基(ここで、mは1～6の整数を表す)、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基)を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すことができる。

上記の好ましい場合において、環状アミノ基はより好ましくは、アミノ基の窒素原子以外に1個の酸素原子、1個の窒素原子、または1個の硫黄原子を含んでいてもよい、5～7員の複素環式基であることができ、特に好ましい飽和の環状

アミノ基としては、ピロリジル、ピペリジル、ピペラジル、モルホルル、チオモルホルル、ホモピペリジル、[1, 4] ジアゼピンが挙げられる。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(II a)または式(II a')を表す場合には、より好ましくは、 $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、これらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5~7員炭素環を形成することができ、特に好ましくは、基Aは $R^2$ および $R^3$ と一緒にナフチル基およびキノリル基を形成することができる。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(II a)または式(II a')を表す場合には、より好ましくは、 $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、同一または異なってもよく、置換基( $C_{1-6}$ アルコキシ( $CH_2CH_2O$ ) m基(ここで、mは1~6の整数を表す))を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すことができる。

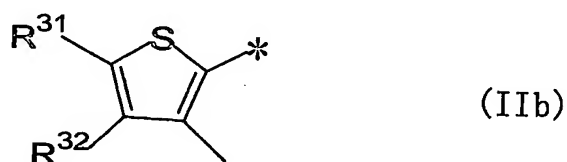
式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(II a)または式(II a')を表す場合には、より好ましくは、 $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が(好ましくは、 $R^2$ が)置換基(好ましくは、水酸基、水酸基により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、酸素原子(=O)、環状アミノ基を形成してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、カルボキシル基)を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基(好ましくは、水酸基、水酸基により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、酸素原子(=O)、環状アミノ基を形成してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、カルボキシル基)を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでもよい)を表し、他方が(好ましくは、 $R^3$ が)水素原子を表す。

上記の好ましい場合において、環状アミノ基はより好ましくは、アミノ基の窒素原子以外に1個の酸素原子、1個の窒素原子、または1個の硫黄原子を含んでもよい、5~7員の複素環式基であることができ、特に好ましい飽和の環状アミノ基としては、ピロリジル、ピペリジル、ピペラジル、モルホルル、チオモルホルル、ホモピペリジル、[1, 4] ジアゼピンが挙げられる。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (II a) または式 (II a') を表す場合には、より好ましくは、 $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  のいずれか一方が (好ましくは、 $R^2$  が) 置換基 (好ましくは、ハロゲン原子、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ-アルキルアミノ基、水酸基、 $C_{1-6}$  アルコキシ ( $CH_2CH_2O$ )  $m$  基 (ここで、 $m$  は 1~6 の整数を表す)、 $C_{3-7}$  シクロアルキル基) を有してもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、他方が (好ましくは、 $R^3$  が) 水素原子を表す。

上記の好ましい場合において、環状アミノ基はより好ましくは、アミノ基の窒素原子以外に 1 個の酸素原子、1 個の窒素原子、または 1 個の硫黄原子を含んでいてもよい、5~7 員の複素環式基であることができ、特に好ましい飽和の環状アミノ基としては、ピロリジル、ピペリジル、ピペラジル、モルホリル、チオモルホリル、ホモピペリジル、[1, 4] ジアゼピンが挙げられる。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、A が表す 5~9 員の不飽和の炭素環部分または 5~9 員の不飽和の複素環部分は、好ましくは、式 (II b) を表す。



(上記式中、 $R^{31}$  および  $R^{32}$  は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；または  $C_{1-6}$  アルキル基 (このアルキル基は (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノ-またはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよい)、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、(14) アリールアミノ基 (このアミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  ア

ルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい) ) ; または $C_{2-6}$ アルケニル基を表し、

$R^{31}$ と $R^{32}$ がアルキル基またはアルケニル基を表す場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に becoming 不飽和の5~7員炭素環を形成してもよく、

\*は $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$ との結合を表す。) )

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(Ib)を表す場合には、好ましくは、

$R^{31}$ および $R^{32}$ は、同一または異なっているてもよく、水素原子; ハロゲン原子; または $C_{1-6}$ アルキル基 (このアルキル基は(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5) $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6) $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) )、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基 (このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい) を表し、

$R^{31}$ と $R^{32}$ がアルキル基を表す場合には、これらのアルキル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に becoming 不飽和の5~7員炭素環を形成してもよく、この場合、 $R^{31}$ と $R^{32}$ とは一緒に becoming  $C_{3-5}$ アルキレン鎖を形成し、---は二重結合を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(IIb)を表す場合には、より好ましくは

(i)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基 ( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基 (好ましくは、ピペリジル、モルホリ

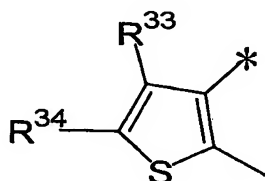
ル、およびチオモルホリル) を形成してもよいモノまたはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、

(iii) R<sup>31</sup>およびR<sup>32</sup>が、同一または異なっているとしてもよく、C<sub>1-6</sub>アルキル基 (C<sub>1-6</sub>アルキル基は、環状アミノ基 (好ましくは、ピペリジル、モルホリル、およびチオモルホリル) を形成してもよいモノまたはジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、あるいは

(iv) R<sup>31</sup>とR<sup>32</sup>が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の5~7員炭素環 (好ましくは、シクロヘキサン環、ベンゼン環、およびシクロペンタン環) を形成している。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(Ib)を表す場合には、より好ましくは、R<sup>31</sup>およびR<sup>32</sup>が水素原子を表すか、またはR<sup>31</sup>およびR<sup>32</sup>のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基を表し、あるいはR<sup>31</sup>とR<sup>32</sup>がそれらが結合している炭素原子と一緒にあって不飽和の5~7員炭素環を形成している。この場合、R<sup>31</sup>とR<sup>32</sup>とが一緒になってC<sub>3-5</sub>アルキレン鎖を形成し、---が二重結合を表していてもよい。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において、Aが表す5~9員の不飽和の炭素環部分または5~9員の不飽和の複素環部分は、好ましくは、式(IIc)を表す。



(IIc)

(上記式中、R<sup>33</sup>およびR<sup>34</sup>は、同一または異なっているとしてもよく、水素原子；ハロゲン原子；またはC<sub>1-6</sub>アルキル基 (このアルキル基は(1)水酸基、(2)

チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基 (このアミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい) を表し、

$R^{33}$  と  $R^{34}$  がアルキル基を表す場合には、これらのアルキル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

\*は  $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$  との結合を表す。) )

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(IIc)を表す場合には、好ましくは、

$R^{33}$  および  $R^{34}$  は、同一または異なっているいてもよく、水素原子；ハロゲン原子；または  $C_{1-6}$  アルキル基 (このアルキル基は(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基 (このアミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい) を表し、

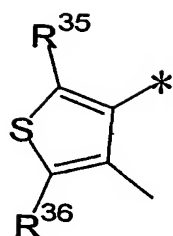
$R^{33}$  と  $R^{34}$  がアルキル基を表す場合には、これらのアルキル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、この場合、 $R^{33}$  と  $R^{34}$  とは一緒に  $C_{3-5}$  アルキレン鎖を形成し、 $\text{---}$  は二重結合を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (Ic) を表す場合には、より好ましくは、

- (i)  $R^{33}$  および  $R^{34}$  が水素原子を表すか、
- (ii)  $R^{33}$  および  $R^{34}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方が  $C_{1-6}$  アルキル基 ( $C_{1-6}$  アルキル基は、環状アミノ基 (好ましくは、ピペリジル、モルホリル、およびチオモルホリル) を形成してもよいモノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、
- (iii)  $R^{33}$  および  $R^{34}$  が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$  アルキル基 ( $C_{1-6}$  アルキル基は、環状アミノ基 (好ましくは、ピペリジル、モルホリル、およびチオモルホリル) を形成してもよいモノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、あるいは
- (iv)  $R^{33}$  と  $R^{34}$  が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の 5 ~ 7 員炭素環 (好ましくは、シクロヘキサン環、ベンゼン環、およびシクロペンタン環) を形成している。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において A が式 (Ic) を表す場合には、より好ましくは、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  が水素原子を表すか、または  $R^{33}$  および  $R^{34}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、あるいは  $R^{33}$  と  $R^{34}$  がそれらが結合している炭素原子と一緒にあって不飽和の 5 ~ 7 員炭素環を形成している。この場合、 $R^{32}$  と  $R^{34}$  とが一緒になって  $C_{3-5}$  アルキレン鎖を形成し、--- が二重結合を表していてもよい。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、A が表す 5 ~ 9 員の飽和または不飽和の炭素環部分または 5 ~ 9 員の飽和または不飽和の複素環部分は、好ましくは、式 (II d) を表す。



(IIId)

(上記式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ は、同一または異なっているとしてもよく、水素原子；ハロゲン原子；または $C_{1-6}$ アルキル基（このアルキル基は(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5) $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6) $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよい）；または $C_{2-6}$ アルケニル基を表し、

\*は $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$ との結合を表す。）

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)においてAが式(IIId)を表す場合には、より好ましくは、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表す。

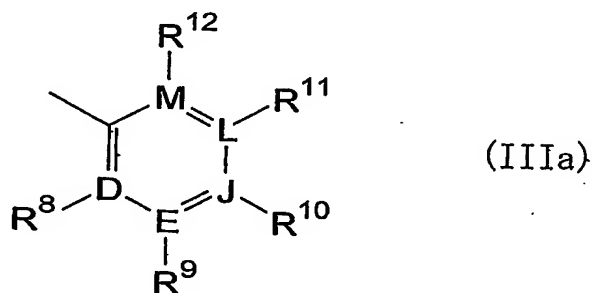
式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において、 $R^5$ は好ましくは、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基（より好ましくは、フェニル基またはナフチル基）、置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（より好ましくは、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、ピリミジル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の9～11員二環性複素環式基（より好ましくは、キノキサリニル基）を表すことができる。

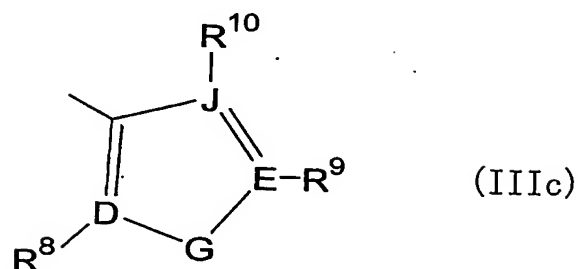
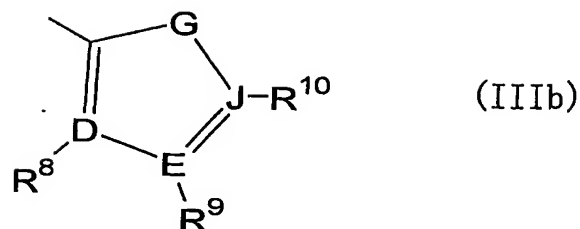


式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、 $R^5$  は、特に好ましくは、 $C_{5-7}$  シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、ピリミジル基、およびキノキサリニル基から選択される環状基（この環状基は、ハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基；または水酸基により置換されていてもよい）を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、 $R^5$  は、特に好ましくは、 $C_{5-7}$  シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、ピリミジル基、およびキノキサリニル基から選択される環状基（この環状基は、 $C_{1-6}$  アルキルにより置換されていてもよく、このアルキル基は、置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基、置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、または置換されていてもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよい）により更に置換されていてもよい）を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、 $R^5$  は、好ましくは、式 (III a)、式 (III b)、または式 (III c) の基を表す。





(上記式中、

D、E、J、L、およびMは、同一または異なっているもよく、炭素原子または窒素原子を表し、

Gは酸素原子または硫黄原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ は、同一または異なっているもよく、

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ-  $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、(8') 複素環式基により置換されたアミノ基（この複素環式基は更に  $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）、(9)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19)  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$ アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21) カルボキシル基、(22) ニトロ基、(23) 複素環式基、(23')  $Het-S(=O)_j-$  (H

e t は複素環式基を表し、j は 0、1、または 2 を表し、H e t はモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい）、(24) シアノ基、および (25) ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基

（ここで、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、および (7)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基のアルキル部分は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよい）、アリーロキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシル基、 $-S(=O)_2(-OH)$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリーロキシ-カルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基（この複素環式基はモノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい）により置換されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$  アルキル（ $C_{1-6}$  アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基（アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）、複素環式基（複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）により置換されていてもよく、アミノ基上の 1

または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成していてもよい) ;  $C_{1-6}$ アルコキシ基 ;  $C_{1-6}$ アルキルチオ基 ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールアミノ基 (アミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい) ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールオキシ基 ; アリールチオ基 ; 酸素原子 ( $=O$ ) ; 水酸基 ; カルボキシ基 ;  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基 ;  $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基 ; アリール基 (このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基 (好ましくは、5~7員飽和または不飽和複素環式基、より好ましくは、ピリジル、ピリミジル、ピリダジル) により更に置換されていてもよく、環状アミノ部分の一つの炭素原子が同一または異なってもよい二つの $C_{1-6}$ アルコキシ基により置換されているとき、この二つのアルコキシ基は一緒になって基- $O-(CH_2)_p-O-$  (ここでpは2~4の整数を表す) を形成してもよく、環状アミノ基は単環性または二環性の芳香族炭素環 (好ましくは、フェニル、ナフチル) または単環性または二環性の芳香族複素環 (好ましくは、ピリジル、ナフチリジル) と縮合して二環性または三環性複素環式基を表すことができる。) ;

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基 ;

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基 ;

(V)  $C_{3-7}$ シクロアルキル基 ;

(VI) アリール基 ;

(VII) アリールオキシ基 ;

(VIII)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基 ;

(VIX)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基；

(X)水酸基；

(XI)ニトロ基；

(XII)シアノ基；

(XIII)アミノ基；

(XIV)モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；

(XV)アリールアミノ基；

(XVI)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基；

(XVII)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-ウレイド基；

(XVIII)  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基；

(XIX)  $C_{1-6}$ アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基；

(XX)  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基；

(XXI)アシル基；

(XXII)カルボキシル基；

(XXIII)カルバモイル基；

(XXIV)モノーまたはジ-アルキルカルバモイル基；

(XXV)複素環式基；

(XXVI)アルキル-またはアリール-スルホニル基；

(XXVII)  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基；

(XXVIII)  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基；または

(XXIX)水素原子

を表し、

D、E、J、L、またはMが窒素原子を表す場合、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ はそれぞれ存在しないか、あるいは窒素原子と一緒になってN-オキシド（ $N \rightarrow O$ ）を形成していてもよい。）

式（I）並びに後記する式（I-1）および式（I-2）において $R^5$ が式（III a）、式（III b）、および式（III c）を表す場合には、

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ が、好ましくは、同一または異なっているとしてもよく、

水素原子；

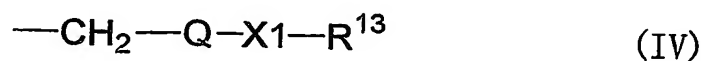
ハロゲン原子；

ヒドロキシメチル基；または

ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において $R^5$ が式 (III a)、式 (III b)、および式 (III c) を表す場合には、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ が表すことがある置換された $C_{1-6}$ アルキル基は、好ましくは、

式 (IV) の基：



(上記式中、

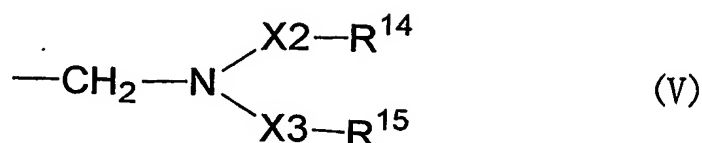
Qは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、またはスルホニル基を表し、

X1は結合または炭素数1～5の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

$R^{13}$ は、水素原子；ハロゲン原子； $C_{1-6}$ アルキル基； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；水酸基；カルボキシル基； $-\text{S}(\text{=O})_2(-\text{OH})$ ； $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基； $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基；アリール基；または複素環式基（この複素環式基はモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基により更に置換されてい

もよく、またこの複素環式基は好ましくは、5または6員の飽和または不飽和の複素環式基を表す)を表す)；

または式(V)の基



(上記式中、

X<sub>2</sub>は結合または炭素数1～5の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

X<sub>3</sub>は結合または炭素数1～5の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

R<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>は、同一または異なっているもよく、水素原子；ハロゲン原子；C<sub>1-6</sub>アルキル（C<sub>1-6</sub>アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリアル基（アリアル基はハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル、もしくはC<sub>1-6</sub>アルキルオキシ基によって置換されているもよい）、複素環式基（複素環式基は、ハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル、もしくはC<sub>1-6</sub>アルキルオキシ基によって置換されているもよい）により置換されているもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つのC<sub>1-6</sub>アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になってC<sub>3-7</sub>シクロアルキル基を形成しているもよい）；C<sub>1-6</sub>アルコキシ基；C<sub>1-6</sub>アルキルチオ基；モノーまたはジ-C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基（ジ-C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成しているもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されているもよい）；アリアルアミノ基（アミノ基は更にC<sub>1-6</sub>アルキル基により置換されているもよい）；モノーまたはジ-C<sub>1-6</sub>アルキルカルバモイルメチル基（ジ-C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成しているもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されているもよい）；アリアルオキシ基；アリアルチオ基；酸素原子(=O)；水酸基；カルボキシル基；C<sub>1-6</sub>アルコキシ-またはアリアルオキシ-カルボニル基；C<sub>1-6</sub>アルキルカルボニル基；アリアル基（このアリアル基はハロゲン原子または水酸基により置換されて

いてもよい) ; または複素環式基 (好ましくは、5 または 6 員の飽和または不飽和の複素環式基) を表し、但し、X 2 が結合を表す場合には  $R^{14}$  は水素原子を表し、X 3 が結合を表す場合には  $R^{15}$  は水素原子を表し、あるいは

$R^{14}$  および  $R^{15}$  はそれらが結合している窒素原子と一緒になって複素環式基を形成してもよく、この複素環式基は  $R^{14}$  および  $R^{15}$  が結合している窒素原子以外に更に 1 ~ 3 個の異種原子 (好ましくは、1 個の酸素原子、1 個の窒素原子、または 1 個の硫黄原子) を含んでいてもよく、この複素環式基は更に水酸基 ;  $C_{1-6}$  アルキル ( $C_{1-6}$  アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基 (アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい) 、複素環式基 (複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい) により置換されていてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分が 2 つの  $C_{1-6}$  アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって  $C_{3-7}$  シクロアルキル基を形成していてもよい) ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; 飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルカルバモイルメチル基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; フェニル基 ; または酸素原子 (=O) により置換されていてもよく、環状アミノ部分の一つの炭素原子が同一または異なってもよい二つの  $C_{1-6}$  アルコキシ基により置換されているとき、この二つのアルコキシ基は一緒になって基-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O- (ここで p は 2 ~ 4 の整数を表す) を形成してもよく、環状アミノ基は単環性または二環性の芳香族炭素環 (好ましくは、フェニル、ナフチル) または単環性または二環性の芳香族複素環 (好ましくは、ピリジル、ナフチリジル) と縮合して二環性または三環性複素環式基を表すことができる。)



を表す。

式 (IV) および式 (V) 中に存在する環状アミノ基は、好ましくは、アミノ基の窒素原子以外に1個の酸素原子、1個の窒素原子、または1個の硫黄原子を含んでいてもよい、5～7員の複素環式基であることができ、より好ましくは、ピペリジル、ピペラジル、モルホルル、チオモルホルルを表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (III a)、式 (III b)、または式 (III c) を表す場合には、好ましくは D、E、J、L、および M が炭素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (III a)、式 (III b)、または式 (III c) を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、および M のいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (III a) を表す場合には、好ましくは D、E、J、L、および M が炭素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (III a) を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、および M のいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (III b) を表す場合には、好ましくは、D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (III c) を表す場合には、好ましくは、D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (III a) を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、および M が炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および  $R^{12}$  のうち一つが水素原子以外の基を表し、残りの基が水素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式

(III a) を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つがハロゲン原子；置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；または置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りの基が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式(III a)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^{10}$ が水素原子以外の基（好ましくは、置換された $C_{1-6}$ アルキル基、より好ましくは式(IV)または式(V)の基）を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式(III a)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^{11}$ が水素原子以外の基（好ましくは、置換された $C_{1-6}$ アルキル基、より好ましくは式(IV)または式(V)の基）を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式(III a)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち二つが水素原子以外の基を表し、残りの基が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式(III a)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、LおよびMが炭素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ が水素原子以外の基（好ましくは置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、より好ましくは置換されていてもよいメトキシ基）を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式(III a)を表す場合には、好ましくは、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^9$ および $R^{11}$ が水素原子以外の基（好ましくは、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、より好ましくは置換されていてもよいメトキシ基）を表し、 $R^8$ 、 $R^{10}$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式

(III b) および式 (III c) を表す場合には、好ましくは、D、E、および J が炭素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I - 1) および式 (I - 2) において  $R^5$  が式 (III b) および式 (III c) を表す場合には、好ましくは、D、E、および J のいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I - 1) および式 (I - 2) において  $R^5$  が式 (III a) を表す場合には、好ましくは、

D、E、J、L、および M が炭素原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および  $R^{12}$  のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているとしてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているとしてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I - 1) および式 (I - 2) において  $R^5$  が式 (III a) を表す場合には、好ましくは、

D、E、J、L、および M のいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および  $R^{12}$  のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているとしてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているとしてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I - 1) および式 (I - 2) において  $R^5$  が式 (III b) を表す場合には、好ましくは、

D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、および  $R^{10}$  のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているとしてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているとしてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I - 1) および式 (I - 2) において  $R^5$  が式 (III c) を表す場合には、好ましくは、

D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、  
 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているも  
 よく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されてい  
 てもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$   
 $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式  
 (IIIa)を表す場合には、好ましくは、

D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、

$R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(Q、X1、および $R^{13}$ は前記に  
 おいて定義された内容と同義である。)または式(V)の基(X2、X3、 $R^{14}$   
 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの  
 基が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式  
 (IIIa)を表す場合には、好ましくは、

D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残  
 りが炭素原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、

$R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(Q、X1、および $R^{13}$ は前記に  
 おいて定義された内容と同義である。)または式(V)の基(X2、X3、 $R^{14}$   
 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの  
 基が水素原子を表す。

式(I)並びに後記する式(I-1)および式(I-2)において $R^5$ が式  
 (IIIb)を表す場合には、好ましくは、

D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基(Q、X1、および $R^{13}$ は  
 前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(X2、X3、  
 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残  
 りの基が水素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において  $R^5$  が式 (IIIc) を表す場合には、好ましくは、

D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、および  $R^{10}$  のうち一つが式 (IV) の基 (Q、X<sup>1</sup>、および  $R^{13}$  は前記において定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、 $R^{14}$ 、および  $R^{15}$  は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、好ましくは、 $R^6$  は、水素原子；置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；または置換基を有していてもよいアリール基を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、 $R^6$  は、より好ましくは、水素原子；ハロゲン原子または  $C_{1-6}$  アルコキシ基により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；またはハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、または  $C_{1-6}$  アルコキシ基により置換されていてもよいアリール基を表し、最も好ましくは、水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表すことができる。

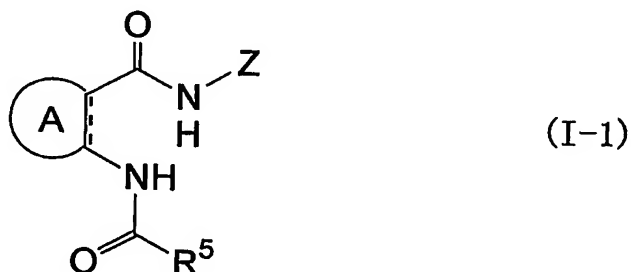
式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、好ましくは、 $R^7$  は、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  $C_{1-6}$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表す。

式 (I) 並びに後記する式 (I-1) および式 (I-2) において、 $R^7$  は、より好ましくは、フェニル基、ナフチル基、フリル基、ピロリル基、およびチエニル基から選択される環状基（この環状基は、ハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基； $C_{1-6}$  アルコキシ基（このアルコキシ基は、ハロゲン原子；アリールオキシ基（このアリールオキシ基はハロゲン原子及び  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されてもよい）； $C_{1-6}$  アルコキシ基（このアルコキシ基は、モノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミン（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに 1~3 個の異種原子を含んでいてもよい）；ハロゲン原子により置換されていてもよい）；ア

リールチオ基（このアリールチオ基はハロゲン原子及び $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）； $C_{1-6}$ アルキルチオ基（このアルキルチオ基は、モノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミン（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ハロゲン原子により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（このアリールアミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキルによって置換されていてもよい）；モノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミン（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）により置換されていてもよい）；水酸基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ニトロ基； $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基；または $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基により置換されていてもよい）を表す。

式（I）並びに後記する式（I-1）および式（I-2）において、好ましくは、 $R^6$ は水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ は、置換基を有してもよいアリール基（好ましくは、フェニル、ナフチル）、置換基を有していてもよいアリール（好ましくは、フェニル、ナフチル） $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール（好ましくは、フェニル、ナフチル） $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（好ましくは、フリル、チエニル、ピロリル、ピリジル）を表す。

式（I）の化合物のうちヒドラジン誘導体は、式（I-1）で表わすことができる。



(上記式中、 $A$ 、 $R^5$ 、 $Z$ 、および $\text{---}$ は式 (I) において定義された内容と同義である。)

式 (I-1) において、好ましくは、

$A$ が式 (IIa) または式 (IIa') (式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、式 (IIa) および式 (IIa') において定義された内容と同義であり、好ましくは、同一または異なっているにもかかわらず、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有しているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；または置換基を有しているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表す。) であり、

$R^5$ が、置換基を有しているもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有しているもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、または置換基を有しているもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (IIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

$Z$ が基 (A)、基 (B)、または基 (C) (式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有しているもよいアリール基 (好ましくは、フェニル、ナフチル)、置換基を有しているもよいアリール (好ましくは、フェニル、ナフチル)  $C_{1-6}$ アルキル基、置換基を有しているもよいアリール (好ましくは、フェニル、ナフチル)  $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有しているもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基 (好ましくは、フリル、チエニル、ピロリル、ピリジル) を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す) を表す。

式 (I-1) において、好ましくは、

$A$ が式 (IIa) (式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、式 (IIa) において定義された内容と同義である。) であり、

$\text{---}$ が二重結合を表し、

$R^5$ が、置換基を有しているもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有しているもよいアリール基、または置換基を有しているもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (IIIa)、式 (IIIb)、または

式 (IIIc) の基を表し、

Zが基 (A) または (B) (式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す) を表す。

式 (I-1) において、好ましくは、

Aが式 (IIb) (式中、 $R^{31}$ および $R^{32}$ は、式 (IIb) において定義された内容と同義であり、好ましくは、 $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、または $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、あるいは $R^{31}$ と $R^{32}$ とが一緒になって $C_{3-5}$ アルキレン鎖を形成している。) であり、

$R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (IIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

Zが基Aまたは基B (式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す) を表す。

式 (I-1) において、好ましくは、

Aが式 (IIc) (式中、 $R^{33}$ および $R^{34}$ は、式 (IIc) において定義された内容と同義であり、好ましくは、 $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、または $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、あるいは $R^{33}$ と $R^{34}$ とが一緒



になって $C_{3-5}$ アルキレン鎖を形成している。)であり、

$R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基（好ましくは、フェニル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基）を表し、より好ましくは、式 (IIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

Zが基Aおよび基B（式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す）

を表す。

式 (I-1) において、好ましくは、

Aが式 (II d)（式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ は、式 (II d) において定義された内容と同義であり、好ましくは、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表す）であり、

$R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基（好ましくは、フェニル基）、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基（好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基）を表し、より好ましくは、式 (IIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

Zが基 (A) または (B)（式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す）

を表す。

式 (I-1) において、より好ましくは、

A が式 (IIa) または式 (IIa') を表し、

式中、

(1)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および  $R^4$  が水素原子を表すか、

(2)  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジアーリールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでもよい）；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$  アルケニルアミノ基（ジ- $C_{2-6}$  アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでもよい）を表し、他方が水素原子を表すか、

(3)  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  が、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表すか、

(4)  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の 5～7 員炭素環を形成するか、

(5)  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  のいずれか一方が置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでもよい）を表し、他方が水素原子を表すか、あるいは

(6)  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  のいずれか一方が置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表し、

$R^5$  が式 (IIIa) を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、および M が炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、

および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基 (式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基 (式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基 (A)、基 (B)、または基 (C) を表し、  
式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式 (I-1) において、より好ましくは、

Aが式 (II a) または式 (II a') を表し、

式中、

(1)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が水素原子を表すか、

(2)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ-アリーールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基(ジ $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、

(3)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、同一または異なっているいてもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すか、

(4)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の5～7員炭素環を形成するか、

(5)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は一緒になって置換基を有していてもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、あるいは

(6)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表し、

$R^5$ が式 (III b) または式 (III c) を表し、

式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているてもよ

く、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、  
式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-1)において、より好ましくは、

Aが式(IIb)を表し、

式中、

(i)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{31}$ と $R^{32}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の5~7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(III a)を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、

式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、また

は置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-1)において、より好ましくは、

Aが式(IIb)を表し、

式中、

(i)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{31}$ と $R^{32}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の5~7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(IIIb)または式(IIIc)を表し、

式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、  
式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  
 $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、また  
は置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-1)において、より好ましくは、

Aが式(IIc)を表し、

式中、

(i)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{33}$ と $R^{34}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の5~7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(IIIa)を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、  
および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、



残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、

式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-1)において、より好ましくは、

Aが式(IIc)を表し、

式中、

(i)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$

アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が、同一または異なっているとしてもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{33}$ と $R^{34}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の5～7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(IIIb)または式(IIIc)を表し、

式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、

式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-1)において、より好ましくは、

Aが式(II d)を表し、

式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^5$ が式 (III a) を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基

(式中、Q、X 1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (式中、X 2、X 3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基 (式中、Q、X 1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (式中、X 2、X 3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基 (A)、基 (B)、または基 (C) を表し、

式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-1)において、より好ましくは、

Aが式(II d)を表し、

式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^5$ が式(III b)または式(III c)を表し、

式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基

(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、

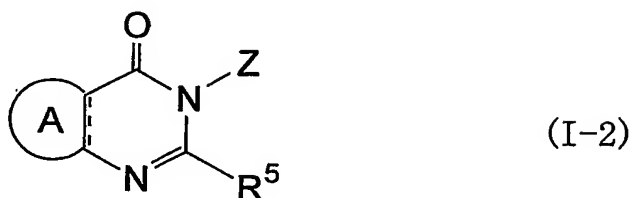
式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

$R^{17}$ が水素原子を表す。

式 (I) の化合物のうちキナゾロン誘導体は、式 (I-2) で表わすことができる。



(上記式中、A、 $R^5$ 、Z、および—は式 (I) において定義された内容と同義である。)

式 (I-2) において、好ましくは、

Aが式 (IIa) または式 (IIa') (式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、式 (IIa) および式 (IIa') において定義された内容と同義であり、好ましくは、同一または異なっているいてもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有しているてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；または置換基を有しているてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表す。) であり、

$R^5$ が、置換基を有しているてもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有しているてもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、または置換基を有しているてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (IIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

Zが基 (A)、基 (B)、または基 (C) (式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有しているてもよいアリール基 (好ましくは、フェニル、ナフチル)、置換基を有しているてもよいアリール (好ましくは、フェニル、ナフチル)  $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有しているてもよいアリール (好ましくは、フェニル、ナフチル)  $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有しているてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基 (好ましくは、フリル、チエニル、ピロリル、ピリジル) を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す)

を表す。

式 (I-2) において、好ましくは、

A が式 (II a) (式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および  $R^4$  は、式 (II a) において定義された内容と同義である。) であり、

— — が二重結合を表し、

$R^5$  が、置換基を有してもよい  $C_{5-7}$  シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (III a)、式 (III b)、または式 (III c) の基を表し、

Z が基 (A) または (B) (式中、 $R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、 $R^7$  が置換基を有してもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、置換基を有していてもよいアリール  $C_{1-6}$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 $R^{17}$  が水素原子を表す) を表す。

式 (I-2) において、好ましくは、

A が式 (II b) (式中、 $R^{31}$  および  $R^{32}$  は、式 (II b) において定義された内容と同義であり、好ましくは、 $R^{31}$  および  $R^{32}$  が水素原子を表すか、または  $R^{31}$  および  $R^{32}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、あるいは  $R^{31}$  と  $R^{32}$  とが一緒になって  $C_{3-5}$  アルキレン鎖を形成している。) であり、

$R^5$  が、置換基を有してもよい  $C_{5-7}$  シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (I II a)、式 (III b)、または式 (III c) の基を表し、

Z が基 A または基 B (式中、 $R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、 $R^7$  が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  $C$

$1-6$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 $R^{17}$  が水素原子を表す)  
を表す。

式 (I-2) において、好ましくは、

A が式 (II c) (式中、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  は、式 (II c) において定義された内容と同義であり、好ましくは、 $R^{33}$  および  $R^{34}$  が水素原子を表すか、または  $R^{33}$  および  $R^{34}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、あるいは  $R^{33}$  と  $R^{34}$  とが一緒になって  $C_{3-5}$  アルキレン鎖を形成している。) であり、

$R^5$  が、置換基を有してもよい  $C_{5-7}$  シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル基、イソキサゾール基、またはピリミジル基) を表し、より好ましくは、式 (IIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

Z が基 A および基 B (式中、 $R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、 $R^7$  が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  $C_{1-6}$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 $R^{17}$  が水素原子を表す)  
を表す。

式 (I-2) において、好ましくは、

A が式 (II d) (式中、 $R^{35}$  および  $R^{36}$  は、式 (II d) において定義された内容と同義であり、 $R^{35}$  および  $R^{36}$  が水素原子を表すか、または  $R^{35}$  および  $R^{36}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基を表す。) であり、

$R^5$  が、置換基を有してもよい  $C_{5-7}$  シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基 (好ましくは、フェニル基)、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 (好ましくは、ピリジル基、チエニル

基、イソキサゾール基、またはピリミジル基)を表し、より好ましくは、式 (I IIa)、式 (IIIb)、または式 (IIIc) の基を表し、

Zが基 (A) または (B) (式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す)

を表す。

式 (I-2) において、より好ましくは、

Aが式 (IIa) または式 (IIa') を表し、

式中、

(1)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が水素原子を表すか、

(2)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ-アリールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基(ジ $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、

(3)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、同一または異なっているてもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すか、

(4)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の5~7員炭素環を形成するか、

(5)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ $C_{1-6}$ アルキルアミ



ノ基は一緒になって置換基を有していてもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、あるいは

(6)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表し、

$R^5$ が式(III a)を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているいてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているいてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているいてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているいてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているいてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているいてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

・ Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、  
式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  
 $C_{1-6}$ アルキル基、置換基を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または  
置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-2)において、より好ましくは、

Aが式(IIa)または式(IIa')を表し、

式中、

(1)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が水素原子を表すか、

(2)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジーアリールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基(ジ $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、

(3)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、同一または異なっているいてもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すか、

(4)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、これらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の5~7員炭素環を形成するか、

(5)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は一緒になって置換基を有していてもよい環状アミノ基を形成してもよく、

環状アミノ基は更に 1 ～ 3 個の異種原子を含んでもよい) を表し、他方が水素原子を表すか、あるいは

(6)  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  のいずれか一方が置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表し、

$R^5$  が式 (III b) または式 (III c) を表し、

式中、

(i) D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および  $R^{10}$  のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および  $R^{10}$  のうち一つが式 (IV) の基 (式中、Q、X 1、および  $R^{13}$  は前記において定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (式中、X 2、X 3、 $R^{14}$ 、および  $R^{15}$  は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表し、

Z が基 (A)、基 (B)、または基 (C) を表し、

式中、

$R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、

$R^7$  が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  $C_{1-6}$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、 $R^{17}$  が水素原子を表す。

式 (I-2) において、より好ましくは、

A が式 (II b) を表し、

式中、

(i)  $R^{31}$  および  $R^{32}$  が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{31}$  および  $R^{32}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方が  $C_{1-6}$  アルキル基 ( $C_{1-6}$  アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ  $C_{1-6}$

アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が、同一または異なっているとしてもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{31}$ と $R^{32}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の5～7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(III a)を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において

定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (式中、 $X_2$ 、 $X_3$ 、 $R^{14}$ 、および  $R^{15}$  は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表し、

$Z$  が基 (A)、基 (B)、または基 (C) を表し、  
式中、

$R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、

$R^7$  が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  $C_{1-6}$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$  が水素原子を表す。

式 (I-2) において、より好ましくは、

A が式 (II b) を表し、

式中、

(i)  $R^{31}$  および  $R^{32}$  が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{31}$  および  $R^{32}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方が  $C_{1-6}$  アルキル基 ( $C_{1-6}$  アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、

(iii)  $R^{31}$  および  $R^{32}$  が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$  アルキル基 ( $C_{1-6}$  アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、あるいは

(iv)  $R^{31}$  と  $R^{32}$  が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の 5 ~ 7 員炭素環を形成し、

$R^5$  が式 (III b) または式 (III c) を表し、

式中、

(i) D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および  $R^{10}$  のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていても

よい  $C_{1-6}$  アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、および J が炭素原子を表し、G が酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および  $R^{10}$  のうち一つが式 (IV) の基（式中、Q、X 1、および  $R^{13}$  は前記において定義された内容と同義である。）または式 (V) の基（式中、X 2、X 3、 $R^{14}$ 、および  $R^{15}$  は前記において定義された内容と同義である。）を表し、残りの基が水素原子を表し、

Z が基 (A)、基 (B)、または基 (C) を表し、  
式中、

$R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、

$R^7$  が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  $C_{1-6}$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$  が水素原子を表す。

式 (I-2) において、より好ましくは、

A が式 (II c) を表し、

式中、

(i)  $R^{33}$  および  $R^{34}$  が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{33}$  および  $R^{34}$  のいずれか一方が水素原子を表し、他方が  $C_{1-6}$  アルキル基（ $C_{1-6}$  アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよい）を表すか、

(iii)  $R^{33}$  および  $R^{34}$  が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$  アルキル基（ $C_{1-6}$  アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよい）を表すか、あるいは

(iv)  $R^{33}$  と  $R^{34}$  が、それらが結合している炭素原子と一緒になって飽和または不飽和の 5～7 員炭素環を形成し、

$R^5$  が式 (III a) を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、

式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有しているもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有しているもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有しているもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

$R^{17}$ が水素原子を表す。

式 (I-2) において、より好ましくは、

Aが式 (II c) を表し、

式中、

(i)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基 ( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、

(iii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基 ( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、あるいは

(iv)  $R^{33}$ と $R^{34}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒にあって飽和または不飽和の5~7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式 (III b) または式 (III c) を表し、

式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式 (IV) の基 (式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。) または式 (V) の基 (式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。) を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基 (A)、基 (B)、または基 (C) を表し、

式中、



$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-2)において、より好ましくは、

Aが式(II d)を表し、

式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^5$ が式(III a)を表し、

式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基

(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式(IV)の基(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記において定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、  
式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$ が水素原子を表す。

式(I-2)において、より好ましくは、

Aが式(II d)を表し、

式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^5$ が式(III b)または式(III c)を表し、  
式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基

(式中、Q、X1、および $R^{13}$ は前記において定義された内容と同義である。)または式(V)の基(式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は前記にお

いて定義された内容と同義である。)を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)を表し、

式中、

$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す。

本発明による化合物の好ましい例としては、実施例に記載の化合物1~1077が挙げられる。

本発明による式(I)の化合物には、

Aが、5~9員の不飽和の炭素環部分または5~9員の不飽和の複素環部分を表し、---が二重結合を表し、

Aが表す炭素環部分および複素環部分が

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c)  $C_{1-6}$ アルキル基；
- (d)  $C_{1-6}$ アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；または
- (j) アミノ基

により置換されていてもよく、

(c)  $C_{1-6}$ アルキル基、(d)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、および(h) アルキルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフォニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルア

ミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよく、

この炭素環部分および複素環部分が2つの(c)  $C_{1-6}$ アルキル基により置換されている場合には、これらのアルキル基は一緒になって $C_{3-5}$ アルキレン鎖を形成してもよく、

$R^5$ が、 $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、または複素環式基を表し、 $R^5$ が表す $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、または複素環式基は、同一または異なっているとしてもよく、下記基：

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノ-またはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、(8') 複素環式基により置換されたアミノ基（この複素環式基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）、(9)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、(12)アリールオキシ基、(13)アリールチオ基、(14)アリールスルフィニル基、(15)アリールスルホニル基、(16)アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-ウレイド基、(19)  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$ アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基、(21)カルボ

キシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')  $\text{Het-S(=O)}_j$  ( $\text{Het}$ は複素環式基を表し、 $j$ は0、1、または2を表し、 $\text{Het}$ はモノーまたはジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル基

(ここで、(4) $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、(5) $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、(6) $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、および(7) $\text{C}_{1-6}$ アルキルスルホニル基のアルキル部分は、ハロゲン原子、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基、モノーまたはジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシ基、 $-\text{S(=O)}_2(-\text{OH})$ 、 $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基、 $\text{C}_{1-6}$ アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基

(この複素環式基はモノーまたはジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基において、ジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子；水酸基により置換されていてもよい $\text{C}_{1-6}$ アルキル； $\text{C}_{1-6}$ アルコキシ基； $\text{C}_{1-6}$ アルキルチオ基；モノーまたはジ- $\text{C}_{1-6}$ アルキルアミノ基 (アミノ基上の1または2つのアルキル基は、水酸基により置換されていてもよい)；アリールアミノ基 (アミノ基は更に $\text{C}_{1-6}$ アルキル基に

より置換されていてもよい) ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールオキシ基 ; アリールチオ基 ; 酸素原子 ; 水酸基 ; カルボキシル基 ;  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基 ;  $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基 ; アリール基 (このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基により更に置換されていてもよい) ;

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基 ;

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基 ;

(V)  $C_{3-7}$ シクロアルキル基 ;

(VI) アリール基 ;

(VII) アリールオキシ基 ;

(VIII)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基 ;

(VIX)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基 ;

(X) 水酸基 ;

(XI) ニトロ基 ;

(XII) シアノ基 ;

(XIII) アミノ基 ;

(XIV) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) ;

(XV) アリールアミノ基 ;

(XVI)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基 ;

(XVII)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-ウレイド基 ;

(XVIII)  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基 ;

(XIX)  $C_{1-6}$ アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基 ;

(XX)  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基 ;

(XXI) アシル基；

(XXII) カルボキシル基；

(XXIII) カルバモイル基；

(XXIV) モノーまたはジールキルカルバモイル基；

(XXV) 複素環式基；

(XXVI) アルキルーまたはアリールースルホニル基；

(XXVII)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基；または

(XXVIII)  $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基

により置換されていてもよく、

Z が基 A または基 B（ここで、 $R^6$ 、 $R^7$ 、および  $R^{17}$  は、式 (I) で定義された内容と同義である）を表し、

$R^{101}$  と  $R^{102}$  が一緒になって  $=O$  を表し、かつ  $R^{103}$  および  $R^{104}$  が水素原子を表すか、あるいは

$R^{101}$  と  $R^{104}$  が一緒になって結合を表し、かつ  $R^{102}$  と  $R^{103}$  とが一緒になって結合を表す化合物が含まれる。

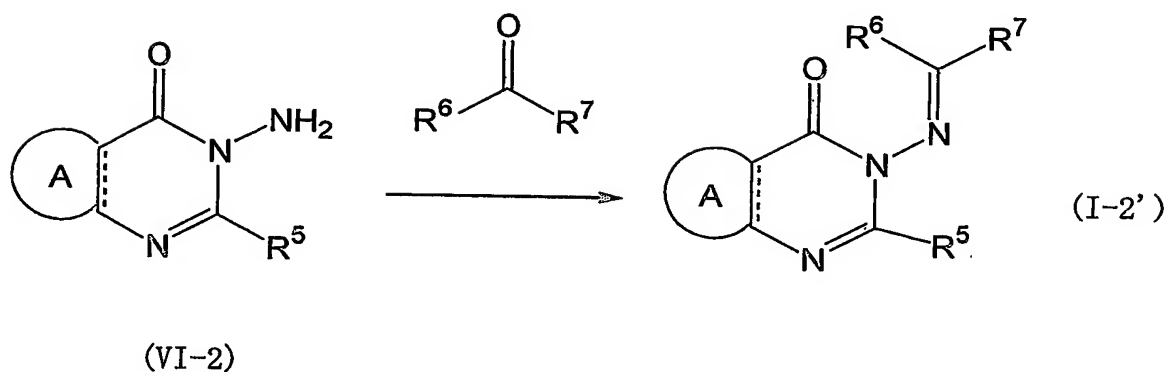
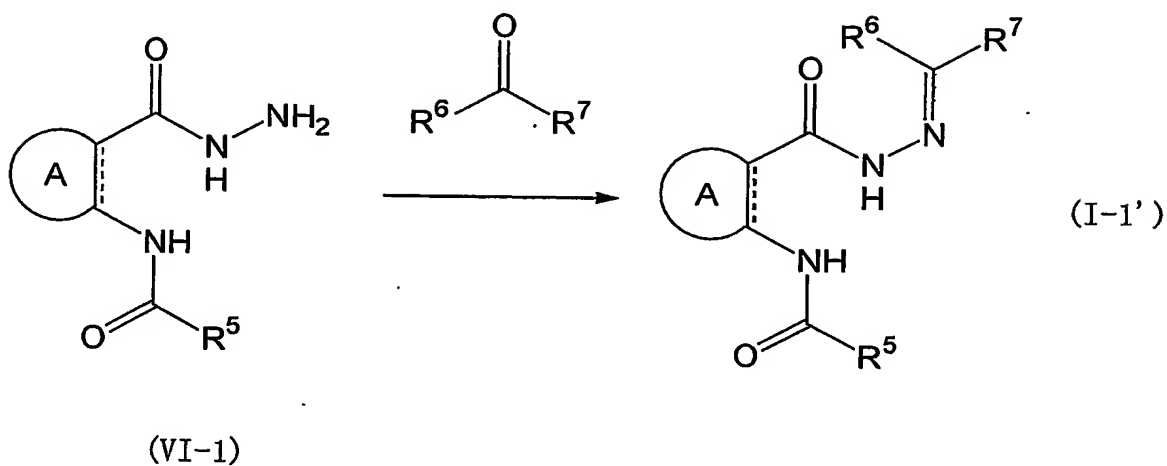
本発明による化合物はその薬学上許容される塩とすることができる。好ましい例としては、ナトリウム塩、カリウム塩またはカルシウム塩のようなアルカリ金属またはアルカリ土類金属塩；フッ化水素酸塩、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩のようなハロゲン化水素酸塩；硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、リン酸塩などの無機酸塩；メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩のような低級アルキルスルホン酸塩；ベンゼンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩のようなアリールスルホン酸塩；フマル酸、コハク酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩、酢酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩、アスコルビン酸塩のような有機酸塩；およびグリシン酸塩、フェニルアラニン酸塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩などが挙げられる。

#### 化合物の製造

式 (I) の化合物は、式 (VI-1) または (VI-2) のヒドラジン化合物を適当な溶媒（例えば、トルエン）中、適当な酸触媒（例えば、酢酸）の存在下で

適当なカルボニル化合物（化合物C）を作用させることにより製造することができる。

スキーム 1



（上記スキーム中、A、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、およびR<sup>7</sup>は式（I）において定義された内容と同義である。）

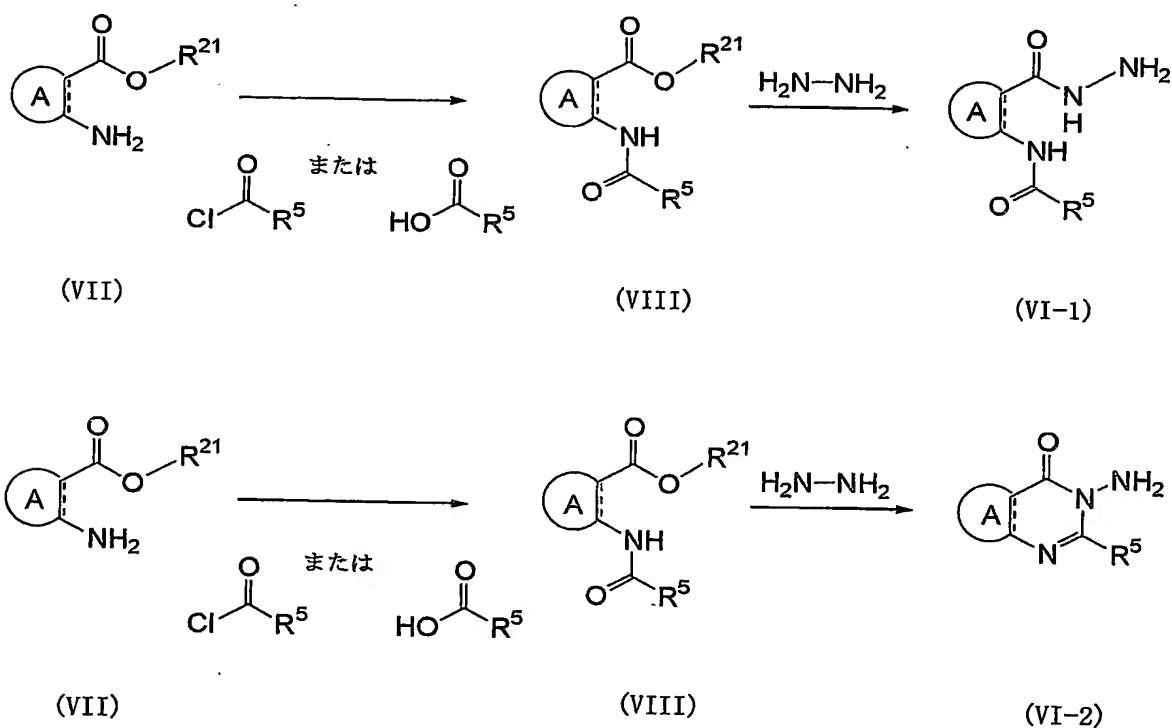
式（VI-1）および式（VI-2）の化合物は、市販されているもの、あるいは後述の方法で製造したものを使用することができる。

式（VI-1）および式（VI-2）の化合物はまた、式（VII）のアミノ化合物（化合物A）に適当な酸クロライド（化合物B）を作用させるか、あるいは適当なカルボン酸（化合物B）を適当な縮合剤（例えば、1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド ハイドロクロライド）の存在下で作用



させることにより式 (VIII) のアミド化合物を製造し、次いで式 (VIII) のアミド化合物を適当な溶媒 (例えばエタノール) 中で、ヒドラジンを添加し、加熱することにより製造することができる。ヒドラジン化反応における反応温度を高温にし、かつ反応時間を増加させることにより、式 (VI-2) の還元体を製造することができる。例えば、30～40℃、12～24時間の反応条件で式 (VI-1) の化合物を、110～120℃、72～96時間の反応条件で式 (VI-2) の化合物を製造することができる。

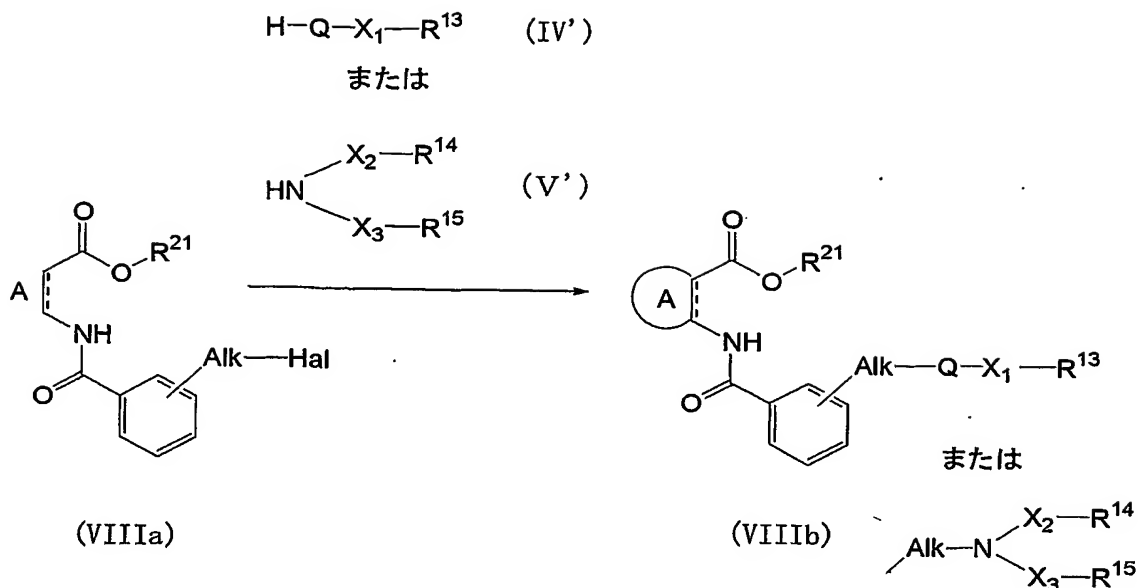
### スキーム 2



(上記スキーム中、Aおよび $R^5$ は式 (I) において定義された内容と同義であり、 $R^{21}$ は水素原子またはカルボキシル基の保護基を表す。)

$R^5$ が式 (IV) または式 (V) により置換されたフェニル基である化合物は、式 (VIIIa) の化合物に式 (IV') または式 (V') の化合物 (化合物 B') を作用させることにより式 (VIIIb) の化合物を得、次いで式 (VIIIb) の化合物をスキーム 1 および 2 の反応に付すことによって得ることができる。

## スキーム 3

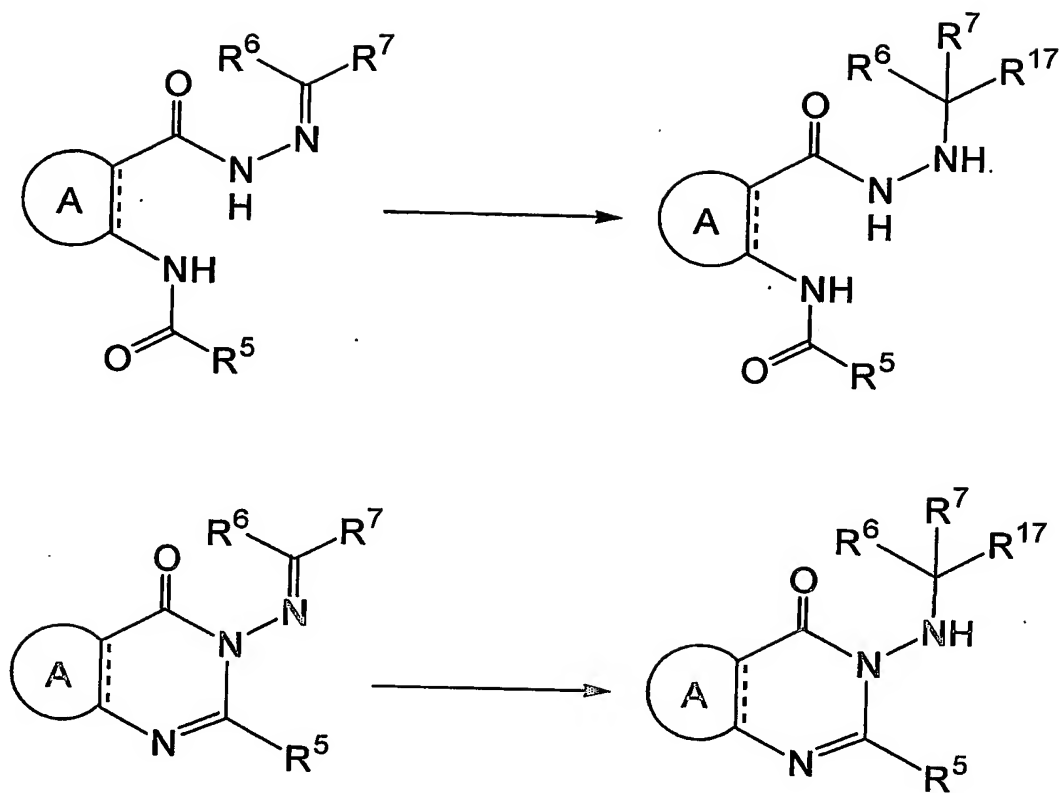


(上記スキーム中、Aおよび $\text{R}^5$ は式(I)において定義された内容と同義であり、Q、 $\text{X}_1$ 、および $\text{R}^{13}$ は式(IV')において定義された内容と同義であり、 $\text{X}_2$ 、 $\text{X}_3$ 、 $\text{R}^{14}$ および $\text{R}^{15}$ は式(V')において定義された内容と同義であり、 $\text{R}^{21}$ は水素原子またはカルボキシル基の保護基を表し、Alkは炭素数1～6のアルキレン鎖を表し、Halはハロゲン原子を表す。)

式(I-3)のタンデム型の化合物もスキーム3に従って製造できる。具体的には、式(VIIIa)の化合物に、式(IV')および式(V')の化合物に代えて、 $\text{H}-\text{NR}^{205}-\text{T}-\text{NR}^{205'}-\text{H}$  ( $\text{R}^{205}$ 、 $\text{R}^{205'}$ 、およびTは式(I-3)において定義された内容と同義である。)を反応させることにより、式(VIIIa)の化合物がタンデムに結合した化合物を得ることができる。この化合物をスキーム1および2の反応付すことにより式(I-3)の化合物を得ることができる。

式(I)においてZが $-\text{NH}-\text{CR}^6\text{R}^7\text{R}^{17}$ であるイミン還元体は、スキーム1で製造された化合物を適当な溶媒(例えば、メタノール)に溶解させ、適当な還元剤(例えば、水素化ホウ素ナトリウム)を用いて還元することにより、製造することができる。

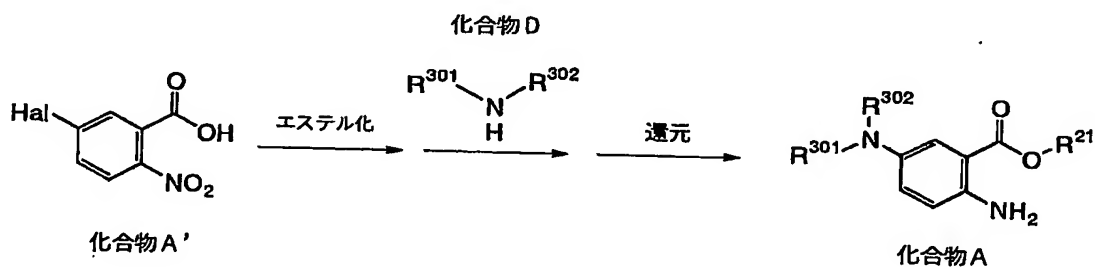
## スキーム 4

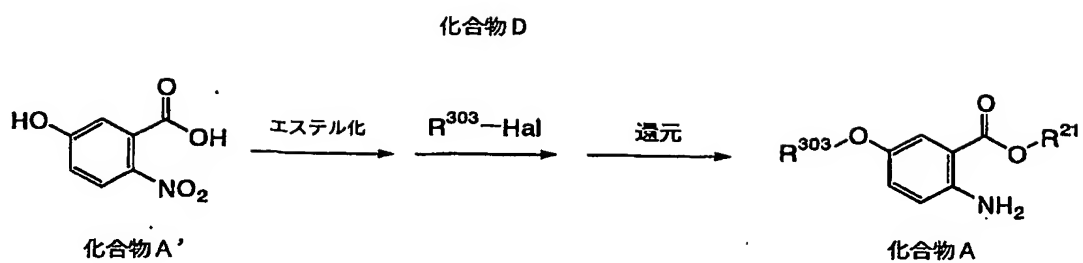
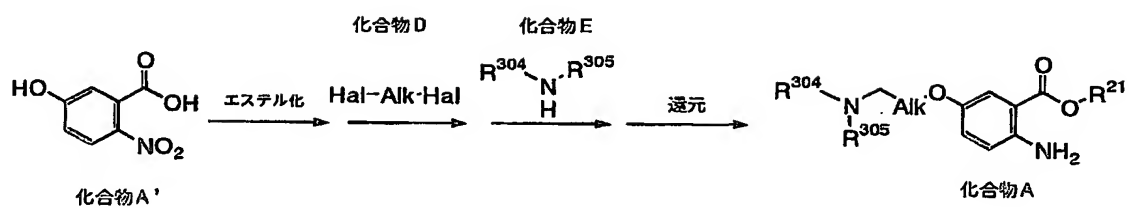
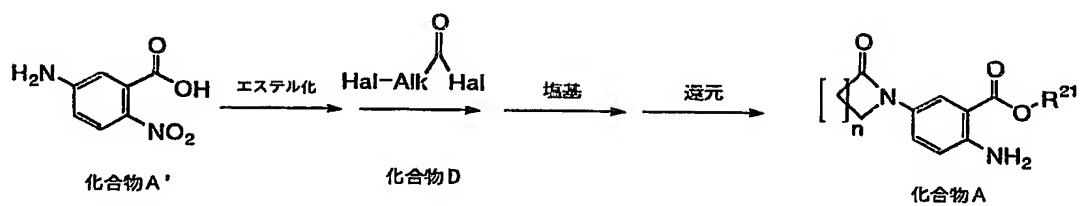
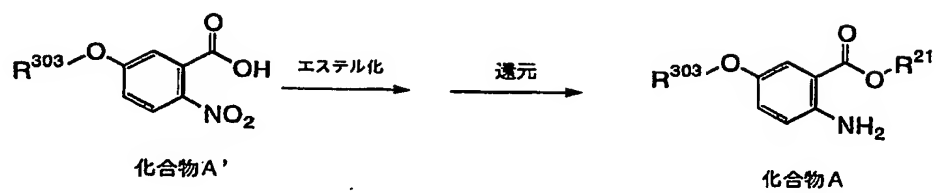


(上記スキーム中、A、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、およびR<sup>17</sup>は式(I)において定義された内容と同義である。)

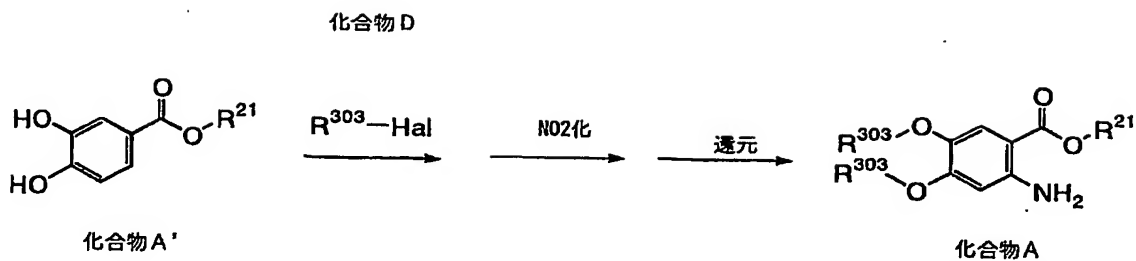
スキーム2で出発化合物として用いられているアミノ化合物のうちA環がベンゼン環である化合物は、スキームA～Hに記載の方法に従って合成できる。

## スキームA

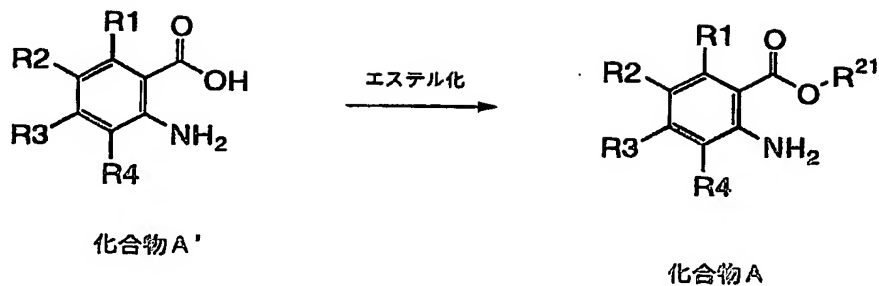


スキーム Bスキーム Cスキーム Dスキーム E

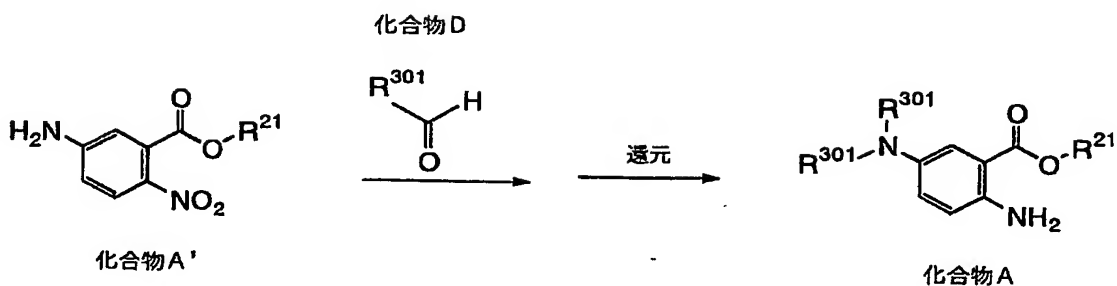
## スキーム F



## スキーム G



## スキーム H



(上記スキーム中、 $R^{21}$ は水素原子またはカルボキシル基の保護基を表し、 $A$ は炭素数2～7のアルキレン鎖を表し、 $n$ は1～6の整数を表し、 $Hal$ はハロゲン原子（好ましくは臭素原子または塩素原子）を表し、 $R^{301}$ 、 $R^{302}$ 、 $R^{303}$ 、 $R^{304}$ 、および $R^{305}$ は置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基、置換されていてもよい $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換されていてもよいアリール基

等を表し、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は式（I）において定義された内容と同義である。）

上記スキーム中、エステル化は市販されているカルボン酸を適当なエステル化剤（例えば、1-エチル-3-（3-ジメチルアミノプロピル）カルボジイミドハイドロクロライド）を用いて実施することができる。

またアミノ基の導入は、塩基性条件下（例えば 炭酸カリウム）にアルキルアミノ化合物もしくはアリールアミノ化合物を作用させることにより実施することができる。

ニトロ基の還元は、適当な還元剤（例えば、パラジウム-炭素）により実施することができる。

#### 化合物の用途

生体内におけるリンの恒常性維持は、細胞に存在するナトリウム依存性リン酸輸送担体（NaPi: sodium dependent phosphate transporter）群によって担われていることが知られている。特に、通常血清リン濃度は腸管上皮細胞でのリン酸の吸収と腎臓尿細管細胞でのリン酸の再吸収によって調節されており、これらの機構にも前述のリン酸輸送担体が関与している。

本発明による化合物は、主に腸管からのリン酸吸収や腎臓からのリン酸再吸収を規定するこれらのリン酸トランスポーターを阻害することができる（薬理試験例1～3参照）。

本発明による化合物はまた、ラットの腸管においてリン酸吸収阻害活性を示す（薬理試験例4参照）。

従って、本発明による化合物は、血清リン低下作用が治療上有効である疾患の予防または治療に用いることができる。

本明細書において、「血清リン低下作用」とは、血清のリン酸濃度を低下させる作用を意味する。血清中のリン酸濃度は、（i）腸管からの吸収と尿および糞への排泄、並びに（ii）体内における細胞や骨組織に代表される石灰化組織との出納で規定される。本明細書において「血清リン低下作用」は、健全な生体に対して作用させた場合において血清中リン酸濃度を低下させる作用も含んでおり、必ずしも高リン血症における血清中リン酸濃度を低下させる作用のみを意味する

ものではない。

本発明による化合物はまた、リン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療に用いることができる。

本明細書において、「リン酸輸送の阻害」とは、対象細胞の細胞膜に存在するリン酸輸送担体の輸送活性を阻害することを意味する。対象細胞としては小腸上皮細胞、腎臓上皮細胞、肺上皮細胞、血管内皮細胞、血管平滑筋細胞または骨芽細胞などが挙げられる。

血清リン低下作用が治療上有効である疾患およびリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患としては（１）高リン血症、（２）腎不全および慢性腎不全、（３）二次性副甲状腺機能亢進症およびこれに関連する疾患、（４）代謝性骨疾患、（５）カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患、および（６）その他の高リン血症に関連する疾患が挙げられる。

#### （１）高リン血症

本発明による化合物は血清中のリン酸濃度を低下させ、リン酸輸送を阻害することができることから、高リン血症の予防または治療に用いることができる。本明細書において「高リン血症」とは血清リン濃度が臨床上定義されている正常域を逸脱している状態を意味する。

#### （２）腎不全および慢性腎不全

腎不全および慢性腎不全に関しては、血清リン濃度の上昇そのものが腎不全の増悪因子であることが近年示唆されている。事実、慢性腎不全患者へのリン酸の摂取制限により腎不全の進行を遅らせることができるという報告も相次いでいる（Maschio et al., *Kidney Int.*, 22:371-376, 1982、Maschio et al., *Kidney Int.*, 24:S273-277, 1983、Barsotti et al., *Kidney Int.* 24:S278-284, 1983）。

よって、リン酸輸送を阻害し、血清中のリン酸濃度を低下させることができる本発明による化合物は、腎不全および慢性腎不全の予防および治療に用いることができる。

#### （３）二次性副甲状腺機能亢進症および原発性副甲状腺機能亢進症並びにこれらに関連する疾患

高リン血症は二次的に低カルシウム血症を招くため二次的な副甲状腺機能亢進

症を誘発することが知られている。従って、本発明による化合物は二次性副甲状腺機能亢進症の予防および治療に用いることができる。

さらに最近ではリン濃度の上昇が副甲状腺細胞からのPTH (parathyroid hormone; 副甲状腺ホルモン) の分泌を促進するとの報告(Almanden Y et al., J Bone Miner Res 11:970-976, 1996)や、リン制限によりその分泌が抑制されるとの報告(Rachel K et al., J Clin Invest 96.327-333, 1995)、副甲状腺の過形成が抑制されるとの報告(Slatopolsky E et al., J Clin Invest 97:2534-2540, 1996)などもある。血清リン濃度自体が副甲状腺の過形成やPTH分泌に関与することを示唆するこれらの報告を踏まえると、本発明による化合物は血清リン濃度を低下させることにより二次性副甲状腺機能亢進症のみならず原発性副甲状腺機能亢進症の予防および治療に用いることができる。本発明による化合物は更に、二次性副甲状腺機能亢進症によって誘導される腎性骨異栄養症、すなわち、線維性骨炎、骨・関節痛、骨変形、骨折などの予防および治療に用いることもできる。

本発明による化合物は二次性副甲状腺機能亢進症を予防および治療することができることから、二次性副甲状腺機能亢進症におけるPTH増加により生ずるといわれている中枢・末梢神経障害、貧血、心筋障害、高脂血症、糖代謝異常、皮膚掻痒、腱断裂、性機能異常、筋肉障害、皮膚虚血性潰瘍、成長遅延、心伝導障害、肺拡散障害、免疫不全、骨・関節痛、骨変形、骨折等の予防および治療にも用いることができる。

#### (4) カルシウム・リン代謝異常疾患

本発明による化合物はリン代謝異常病態を是正できるに留まらず、カルシウムを含めたミネラル代謝異常病態に対しても改善作用を有すると考えられる。従って本発明による化合物は代謝性骨疾患のようなカルシウム・リン代謝異常疾患の予防および治療に用いることができる。

#### (5) カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患

透析患者においては、多量のカルシウム製剤の投与やビタミンD投与、タンパクの過剰摂取による血清リン濃度の管理不良といった状態が発生すると、血中のカルシウム・リン積の上昇により異所性石灰化が生じやすくなり、ひいては冠動



脈をはじめとした血管系の石灰化により循環器系障害の原因ともなっている (Braun J et.al., Am J Kidney Dis. 27:394-401, 1996、Goodman WG et.al., N Engl J Med 342:1478-1483, 2000、Kimura K et.al., Kidney Int. 71:S238-241, 1999)。このような場合、カルシウム・リン積の下方修正が病態の改善に有効である (Geoffrey AB et.al., Am J Kidney Dis. 31:607-617, 1998)。本発明による化合物はカルシウム製剤とは異なる高リン血症改善薬であることから、血清中のカルシウム濃度を上昇させることなく血清中のリン濃度を低下させることができる。よって本発明による化合物は、血管におけるカルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患の治療に用いることができる。このような疾患としては、透析患者における心血管系の石灰化、加齢による動脈硬化、糖尿病性血管症、軟部組織石灰化、転移性石灰化、異所性石灰化が挙げられる。カルシウム・リン積の上昇はred eye、関節痛、筋肉痛、皮膚掻痒、心伝導障害、肺拡張障害、狭心症、心筋梗塞、心雑音や弁膜症による心不全といった病態の危険因子であることも認知されていることから (Tetsuo Tagami, 腎と透析vol. 49: 189-191, 2000)、これらの予防および治療にも用いることができる。

#### (6) その他の高リン血症に関連する疾患

上記(1)～(5)以外に、副甲状腺機能低下症、偽性副甲状腺機能低下症、低カルシウム血症、高カルシウム尿症、ビタミンD中毒症、末端肥大症、リン酸塩の過剰投与、アシドーシス、異化亢進状態、横紋筋融解症、溶血性貧血、更年期障害、悪性腫瘍、腫瘍崩壊症候群、および腫瘍性石灰沈着症も高リン血症を伴うことから、本発明による化合物はこれらの疾患の予防および治療に用いることもできる。

本発明によれば、本発明による化合物を含んでなる、血清リン濃度低下剤が提供される。

本発明によれば、本発明による化合物を含んでなる、リン酸輸送阻害剤が提供される。

本発明によればまた、本発明による化合物をヒトまたはヒト以外の哺乳類に投与することを含んでなる、血清リン濃度の低下方法が提供される。

本発明によれば、本発明による化合物をヒトまたはヒト以外の哺乳類に投与す

ることを含んでなる、リン酸輸送の阻害方法が提供される。

### 医薬製剤

本発明による化合物は、経口および非経口（例えば、口腔内、経鼻、経肺、直腸内、経皮、皮下、静脈内）のいずれかの投与経路で、ヒトおよびヒト以外の動物に投与することができる。従って、本発明による化合物は、投与経路に応じた適当な剤型に処方することができる。上記投与に適した剤形としては、錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤、軟膏剤、ハップ剤、エアゾール剤、坐剤、注射剤等が挙げられる。

本発明による化合物それ自体を患者に投与することができるが、汎用の製剤用添加物とともに患者に投与することができる。

本発明による医薬組成物は、周知の製剤技術に従って、本発明による化合物を下記に記載した添加物とともに使用することにより製造することができる。

例えば、本発明による化合物と適当な製剤用添加物を使用し、従来汎用の方法により経口製剤、すなわち錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤を製造することができる。経口製剤に使用できる添加物は、賦形剤、結合剤、崩壊剤、滑沢剤等のなかから適当なものを単独あるいは組み合わせて用いることができる。賦形剤としては、例えば、乳糖、マンニトール、トウモロコシデンプン、炭酸カルシウムなどが挙げられる。結合剤としては、例えば、アラビアゴム、トラガント、ゼラチン、メチルセルロースなどが挙げられる。崩壊剤としては、例えば、トウモロコシデンプン、結晶セルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウムなどが挙げられる。滑沢剤としては、例えば、タルク、ステアリン酸マグネシウムなどが挙げられる。

本発明による化合物を含有する経口製剤は、周知の方法に従って、コーティング剤を用いてコーティングを施すこともできる。コーティング剤としては、例えば、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、アミノアルキルメタアクリレートコポリマー、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、カルボキシメチルエチルセルロースなどを用いることができる。

本発明による化合物の腸管からのリン吸収を阻害する作用を効果的に引き出すために経口製剤に改変を加えてもよい。

本発明による化合物は経口投与された場合、小腸上皮細胞におけるリン酸輸送担体を阻害した後、体内に吸収されて血管内皮細胞、肺上皮細胞、腎臓上皮細胞、骨芽細胞等におけるリン酸輸送担体を阻害する可能性を有する。従って、本発明による化合物が腸管からのリン酸吸収を阻害するとともに、腎臓でのリン酸吸収を阻害することにより、相乗的にかつ効果的に血清リン酸濃度を低下させる可能性を有する。本発明による化合物が体内に吸収された場合には、未知の毒性を引き起こす可能性も否定できない。そこで本発明による化合物を腸管から吸収させることなく体外からのリン酸吸収にとって最初の関門である小腸上皮のみを特異的に阻害する工夫を施してもよい。例えば、本発明の化合物に不活性な水溶性の高分子を結合させることにより、水溶性と分子量の増大をもたらすことで化合物自身の腸管からの吸収を防いでもよい。水溶性の高分子としては、例えば、ポリエチレングリコール、デキストラン、ゼラチンなどを用いることができる。

本発明による経口製剤はまた、経口投与後、腸管で特異的に溶解させるために腸溶コーティングを施してもよい。腸溶コーティングは、周知の方法に従って、腸溶コーティング剤を用いて行うことができる。腸溶コーティング剤としては、例えば、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートサクシネート、カルボキシメチルエチルセルロース、メタアクリル酸コポリマーなどが挙げられる。

本発明による経口製剤には更に、経口投与後、腸管で迅速に溶解させて有効成分の濃度を高める発泡性を発揮する物質を添加することができる。溶解時に発泡性を発揮する物質としては、例えば、炭酸水素ナトリウムとクエン酸の組み合わせなどを用いることができる。

本発明による経口製剤には更にまた、経口投与後、腸管における滞留性を向上させる物質を添加することができる。滞留性を向上させる物質としては、溶解時に粘性を示す物質が挙げられ、例えば、アルギン酸ナトリウム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、カルボキシルビニルポリマー、キトサンなどを用いることができる。

本発明による経口製剤においては上記改変を適宜組み合わせてもよい。

本発明による化合物と適当な製剤用添加物を使用し、従来汎用の方法により注射剤を製造することができる。注射剤に使用できる添加物は、希釈剤、pH調整剤、等張化剤、溶解補助剤、防腐剤等のなかから適当なものを単独あるいは組み合わせ用いることができる。希釈剤としては、例えば、注射用蒸留水などが挙げられる。pH調整剤としては、例えば、塩酸、水酸化ナトリウム、酢酸と酢酸ナトリウムの組み合わせ、リン酸水素ナトリウムとリン酸二水素ナトリウムの組み合わせなどが挙げられる。等張化剤としては、例えば、塩化ナトリウム、ブドウ糖、マンニトール、グリシンなどが挙げられる。溶解補助剤としては、例えば、エタノール、ポリソルベート20、ポリソルベート80、ショ糖脂肪酸エステル、プロピレングリコールなどが挙げられる。防腐剤としては、例えば、クロロブタノール、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウムなどが挙げられる。

本発明による化合物の投与量は、患者の年齢、体重、性別、疾患の相違、症状の程度などを考慮して、個々の場合に依じて適宜決定されるが、例えば、0.1～1000mg/kg、好ましくは、0.5～1000mg/kg、より好ましくは、1～20mg/kgの範囲であり、これを1日1回または数回に分けて投与する。

### 実 施 例

以下、実施例を挙げて具体的に説明するが、本発明の範囲はこれらの実施例によって制限されるものではない。

#### 実施例1

**化合物1** 3,4-ジメトキシ-N-[2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

メチル 2-アミノベンゾエート (化合物A) (2.0g) を、無水塩化メチレン (40.0ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2.0ml)、3,4-ジメトキシベンゾイルクロライド (化合物B) (3.14g) をそれぞれ加え、同温度にて30分攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 2-

[ (3, 4-ジメトキシベンゾイル) アミノ] ベンゾエート (4.17 g, 収率 100%) を得た。

上記反応で得られた、メチル 2- [ (3, 4-ジメトキシベンゾイル) アミノ] ベンゾエート (4.17 g) を、エタノール (40.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (20.0 ml) を加え、加熱還流下で 12 時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロータ (φ 40 mm) を用いて濾過し、結晶をエーテルにて洗浄し、ヒドラジン化合物である N- (2-ヒドラジノカルボニル-フェニル) -3, 4-ジメトキシベンズアミド (3.55 g, 収率 91.3%) を得た。

N- (2-ヒドラジノカルボニル-フェニル) -3, 4-ジメトキシベンズアミド (50.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて触媒量の酢酸、トランス-シナナムアルデヒド (化合物 C) (40.0 μl) を添加し、加熱還流下にて 30 分攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロータ (φ 21 mm) を用いて濾過し、結晶をトルエン、ヘキサンを用いて洗浄した。結晶を真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物 1 (39.0 mg, 収率 57.0%) を得た。

質量分析 (ESI-MS) 428 (M-1)

化合物 2 N- [2- (2-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

化合物 3 3, 4-ジメトキシ-N- [2- (2-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 416 (M-1)

化合物 4 3, 4-ジメトキシ-N- [2- (2-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

化合物 5 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

化合物 6 N-[2-(3, 5-ジ-tert-ブチル-4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

化合物 7 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(2-メチル-3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 442 (M-1)

化合物 8 N-[2-(3, 5-ビス-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 538 (M-1)

化合物 9 N-[2-(3-シアノベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 427 (M-1)

化合物 10 N-[2-(2-ブロモベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 10 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

化合物 11 N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 448 (M-1)

化合物 1 2 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(3, 4, 5-トリメトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 492 (M-1)

化合物 1 3 N-[4-プロモ-2-(3-フェニル-アリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

化合物 1 4 N-[4-プロモ-2-(2-プロモ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 560 (M-1)

化合物 1 5 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

化合物 1 6 N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

化合物 1 7 N-[2-(ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 402 (M-1)

化合物 1 8 N-[2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 418 (M-1)

化合物 19 N-[2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 19 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 418 (M-1)

化合物 20 3,4-ジメトキシ-N-[2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 20 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 416 (M-1)

化合物 21 N-[2-(フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 21 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 392 (M-1)

化合物 22 3,4-ジメトキシ-N-[2-(5-メチルフラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 22 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 406 (M-1)

化合物 23 3,4-ジメトキシ-N-[2-(チオフェン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 23 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 408 (M-1)

化合物 24 3,4-ジメトキシ-N-[2-(チオフェン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 24 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 408 (M-1)

化合物 25 N-[2-(2,4-ジヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 25 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)



化合物 26 N- [2- (3, 4-ジヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 26 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

化合物 27 N- [2- (ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -2-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 27 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 360 (M-1)

化合物 28 N- [4-ブロモ-2- (2-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 28 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 500 (M-1)

化合物 29 N- [4-ブロモ-2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 29 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.32 (1H, bs), 7.49-7.67 (6H, m), 7.40 (1H, q,  $J=4.56$  Hz), 7.13 (1H, q,  $J=5.53$  Hz), 6.93 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.98 (3H, s), 3.94 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 500 (M-1)

化合物 30 N- [4-ブロモ-2- (2-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 30 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

化合物 31 N- [4-ブロモ-2- (3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 31 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

化合物 3 2 N- [2- (3-クロロ-4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 (M-1)

化合物 3 3 3, 4-ジメトキシ-N- [2- (4-トリフルオロメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 486 (M-1)

化合物 3 4 N- [2- (3-プロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 512 (M-1)

化合物 3 5 N- [2- (3-クロロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

化合物 3 6 N- [2- (4-ヒドロキシ-3, 5-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

化合物 3 7 N- [2- (3-エトキシ-4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462 (M-1)

化合物 3 8 2-フルオロ-N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

化合物 3 9 2-フルオロ-N- [2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒド

ラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 39 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

化合物 40 2-フルオロ-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 40 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

化合物 41 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 41 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

化合物 42 N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 42 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

化合物 43 N-[2-(2, 5-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 43 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

化合物 44 N-[2-(2-フルオロ-5-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 44 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 488 (M-1)

化合物 45 2-フルオロ-N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 45 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 390 (M-1)

化合物 46 N-[2-(2, 5-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -2-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

化合物 4 7 N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-メトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 390 (M-1)

化合物 4 8 N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-メトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 390 (M-1)

化合物 4 9 4-メトキシ-N- [2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 386 (M-1)

化合物 5 0 N- [2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-メトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

化合物 5 1 4-メトキシ-N- [2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 386 (M-1)

化合物 5 2 N- [2- (4-アリルオキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 458 (M-1)

化合物 5 3 N- [2- (3, 5-ジメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462 (M-1)

化合物 54 3, 4-ジメトキシ-N- {2- [3- (3-トリフルオロメチル-フェノキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 54 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 562 (M-1)

化合物 55 N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 55 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

化合物 56 N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 56 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 420 (M-1)

化合物 57 3, 5-ジメトキシ-N- [2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 57 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 416 (M-1)

化合物 58 N- [2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 58 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 418 (M-1)

化合物 59 N- [4-プロモ-2- (3-クロロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 59 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 516 (M-1)

化合物 60 N- [4-プロモ-2- (4-クロロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 60 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 516 (M-1)

化合物 6 1 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 500 (M-1)

化合物 6 2 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

化合物 6 3 N-[4-ブromo-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

化合物 6 4 N-[4-ブromo-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

化合物 6 5 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 (M-1)

化合物 6 6 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 (M-1)

化合物 6 7 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 6 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

化合物 68 N-〔4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 68 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.33 (1H, s), 8.72 (1H, d,  $J=8.76$  Hz), 8.21 (1H, s), 7.48–7.68 (6H, m), 7.20–7.25 (1H, m), 6.92 (1H, d,  $J=8.56$  Hz), 3.97 (3H, s), 3.93 (3H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

化合物 69 N-〔4-クロロ-2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 69 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 (M-1)

化合物 70 N-〔4-クロロ-2-(4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 70 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 (M-1)

化合物 71 N-〔5-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 71 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 (M-1)

化合物 72 N-〔5-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 72 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454 (M-1)

化合物 73 N-〔5-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 73 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

化合物 7 4 N- [5-クロロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 (M-1)

化合物 7 5 N- [5-クロロ-2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 452 (M-1)

化合物 7 6 4-フルオロ-N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 379 (M-1)、757 (2M-1)

化合物 7 7 4-フルオロ-N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

化合物 7 8 4-フルオロ-N- [2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

化合物 7 9 4-フルオロ-N- [2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

化合物 8 0 4-フルオロ-N- [2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

化合物 8 1 3-フルオロ-N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ



ジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

化合物 8 2 3-フルオロ-N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 757 (2M-1)

化合物 8 3 3-フルオロ-N-[2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

化合物 8 4 3-フルオロ-N-[2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

化合物 8 5 3-フルオロ-N-[2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

化合物 8 6 3-フルオロ-N-[2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 376 (M-1)

化合物 8 7 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 8 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 582、584 (M-1)

化合物 8 8 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル

ベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 88 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.49 (1H, d,  $J=8.08\text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.49-7.60 (4H, m), 7.41 (1H, d,  $J=9.04\text{ Hz}$ ), 6.94 (1H, d,  $J=8.56\text{ Hz}$ ), 3.98 (3H, s, ), 3.94 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 538、540 ( $M-1$ )

化合物 89 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 89 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 504、506 ( $M-1$ )

化合物 90 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 4-メトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 90 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 474 ( $M-1$ )

化合物 91 N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 91 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.53 (1H, s), 8.61 (1H, d,  $J=9.04\text{ Hz}$ ), 8.21 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.59-7.62 (4H, m), 7.46-7.50 (1H, m), 7.17 (1H, d,  $J=7.56\text{ Hz}$ ), 6.91 (1H, d,  $J=8.28\text{ Hz}$ ), 3.97 (3H, s), 3.93 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 508 ( $M-1$ )

化合物 92 N-[4-クロロ-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 2 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  9.60 (1H, s), 8.65 (1H, d,  $J=9.04\text{Hz}$ ), 8.21 (1H, s), 7.44–7.62 (6H, m), 7.17 (1H, d,  $J=7.80\text{Hz}$ ), 6.91 (1H, d,  $J=8.32\text{Hz}$ ), 3.97 (3H, s), 3.92 (3H, s), 2.28 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 464 (M-1)

化合物 9 3 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

化合物 9 4 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 400 (M-1)

化合物 9 5 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

化合物 9 6 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 388 (M-1)

化合物 9 7 N-[4-プロモ-2-(3-プロモ-4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 9 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 590 (M-1)

化合物 9 8 N-[2-(3-プロモ-4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-クロロフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 98 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 544 (M-1)

化合物 99 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 99 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 510 (M-1)

化合物 100 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 100 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 482 (M-1)

化合物 101 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 101 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 468、470 (M-1)

化合物 102 N-[2-(3-ブロモ-4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 102 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 468、470 (M-1)

化合物 103 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(3-ニトロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 103 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 447 (M-1)

化合物 104 N-[2-(4-ジメチルアミノ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 104 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 445 (M-1)

化合物 105 N-[4-ブロモ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 105 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 458 (M-1)

化合物 106 N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 106 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 456 (M-1)

化合物 107 N-[4-ブロモ-2-(3-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 107 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 472、474 (M-1)

化合物 108 N-[4-ブロモ-2-(4-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 108 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 472、474 (M-1)

化合物 109 N-[4-ブロモ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 109 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 456、458 (M-1)

化合物 110 N-[4-ブロモ-2-(ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 110 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 483 (M-1)

化合物 111 N-[4-クロロ-2-(ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 111 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437 (M-1)

化合物 112 4-メトキシ-N-[2-(ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 112 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 373 (M-1)

化合物 1 1 3 4-フルオロ-N-[2-(ピリジン-3-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 1 1 4 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 498 (M-1)

化合物 1 1 5 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 498、500 (M-1)

化合物 1 1 6 N-[4-ブromo-2-(3-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 516、518 (M-1)

化合物 1 1 7 N-[4-ブromo-2-(4-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 514、516 (M-1)

化合物 1 1 8 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

化合物 1 1 9 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 1 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

化合物 1 2 0 N-[2-(3-フルオロベンジリデン)-ヒドラジノカルボ

ニル) -フェニル) - 3 -トリフルオロメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 444 (M-1)

化合物 1 2 1 N- [2 - (4 -フルオロ-ベンジリデン) -ヒドラジノカルボニル) -フェニル) - 3 -トリフルオロメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 444 (M-1)

化合物 1 2 2 N- [2 - (3 -クロロ-ベンジリデン) -ヒドラジノカルボニル) -フェニル) - 3 -トリフルオロメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 459, 461 (M-1)

化合物 1 2 3 N- [2 - (4 -クロロ-ベンジリデン) -ヒドラジノカルボニル) -フェニル) - 3 -トリフルオロメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 459, 461 (M-1)

化合物 1 2 4 N- [2 - (4 -メチル-ベンジリデン) -ヒドラジノカルボニル) -フェニル) - 3 -トリフルオロメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

化合物 1 2 5 N- [4 - (3 -ジメチルアミノ-プロポキシ) -2 - (4 -フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 4 -ジメトキシ-ベンズアミド

N- (2 -クロロエチル) -N, N-ジメチルアミン塩酸塩を 3 -ジメチルアミノプロピルクロライド塩酸塩に変更した以外は実施例 2 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 521, 523 (M-1)

化合物 1 2 6 N- [4 -クロロ-2 - (3, 4 -ジメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 4 -ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 2 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

化合物 127 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 127 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 540 (M-1)

化合物 128 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,5-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 128 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

化合物 129 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 129 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 130 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 130 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.69 (1H, s), 9.28 (1H, s), 8.77 (1H, dd,  $J=1.44\text{ Hz}$ ,  $J=4.88\text{ Hz}$ ), 8.66 (1H, d,  $J=7.80\text{ Hz}$ ), 8.25-8.33 (2H, m), 7.81 (2H, s), 7.50-7.60 (2H, m), 7.43 (1H, dd,  $J=4.88\text{ Hz}$ ,  $J=8.04\text{ Hz}$ ), 7.05-7.15 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 131 N-[2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 131 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

化合物 132 N-[2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド



実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

化合物 1 3 3 N- [2- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

化合物 1 3 4 N- [2- (3-フルオローベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 1 3 5 N- [2- (4-フルオローベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 1 3 6 N- [2- (3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

化合物 1 3 7 N- [2- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

化合物 1 3 8 N- [2- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 3 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

## 実施例 2

化合物 1 3 9 N- [4- (2-ジメチルアミノ-エトキシ) -2- (4-フルオローベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキ

# シーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って合成した N- [2- (4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヒドロキシフェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド (50 mg) を、無水DMF (1.5 ml) に溶解させ、室温にてNaH (60% in oil, 20 mg) を加え、同温度にて5分間攪拌した。続いて、室温にてN- (2-クロロエチル) -N, N-ジメチルアミン塩酸塩 (47 mg) を加え、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、氷冷下にて蒸留水を滴下し、酢酸エチルにて分液抽出を行ない、得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥させ有機層を減圧下にて濃縮した。得られた残渣をプレパラティブTLCにて精製し、表題の化合物 139 を (32 mg、収率 57.1%) 得た。

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

化合物 140 N- [4- (2-ジエチルアミノエトキシ) -2- (4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

N- (2-クロロエチル) -N, N-ジメチルアミン塩酸塩を2-ジエチルアミノエチルクロライド塩酸塩に変更した以外は実施例 2 に記載の方法に従って、表題の化合物 140 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

化合物 141 N- [2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メトキシフェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 141 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

化合物 142 N- [2- (4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メトキシフェニル] -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 142 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 450 (M-1)

化合物 143 3, 4-ジメトキシ-N- [4-メトキシ-2- (3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

化合物 1 4 4 3, 4-ジメトキシ-N-[4-メトキシ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

化合物 1 4 5 N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシ-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 460 (M-1)

化合物 1 4 6 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

化合物 1 4 7 N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

化合物 1 4 8 3, 4-ジメトキシ-N-[4-メチル-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

化合物 1 4 9 3, 4-ジメトキシ-N-[4-メチル-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 4 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 430 (M-1)

化合物 1 5 0 N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 5 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 444 (M-1)

化合物 151 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 151 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 428 (M-1)

化合物 152 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 152 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 428 (M-1)

化合物 153 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 153 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 426 (M-1)

化合物 154 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 154 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 424 (M-1)

化合物 155 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 155 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 438 (M-1)

化合物 156 フラン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 156 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 513、514 (M-1)

化合物 157 チオフエン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

ミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 5 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

化合物 1 5 8 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 5 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 446 (M-1)

化合物 1 5 9 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 5 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

化合物 1 6 0 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 6 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

化合物 1 6 1 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 6 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 454、456 (M-1)

化合物 1 6 2 チオフェン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 6 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

実施例 3

化合物 1 6 3 N-〔2-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-イソニコチンアミド 塩酸塩

実施例 1 に記載の方法に従って合成した化合物 1 3 8 (50 mg) に室温にて 10%-塩酸メタノールを溶液 (1.0 ml) を加え、さらにジエチルエーテル (5.0 ml) を加え 30 秒間攪拌した。反応液をそのまま桐山ロート ( $\phi$  21 mm) を用いて濾過し、結晶をジエチルエーテルにより洗浄し、表題の化合物 1 6 3 (47 mg、収率 85.6%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (MeOH- $d_4$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.97 (2H, d,  $J=6.84$  Hz), 8.49 (1H, d,  $J=8.08$  Hz), 8.41 (2H, d,  $J=6.56$  Hz), 8.23 (1H, s), 7.84 (1H, d,  $J=6.56$  Hz), 7.56-7.61 (2H, m), 7.44 (1H, d,  $J=7.80$  Hz), 7.28 (1H, dd,  $J=7.32$  Hz,  $J=7.32$  Hz), 7.12 (1H, d,  $J=7.80$  Hz), 2.23 (3H, s), 2.22 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

化合物 1 6 4 N-〔2-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-ニコチンアミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 6 4 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (MeOH- $d_4$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.22 (1H, s), 8.87 (1H, d,  $J=5.4$  Hz), 8.83 (1H, d,  $J=8.04$  Hz), 8.43 (1H, d,  $J=8.32$  Hz), 8.25 (1H, s), 7.97-8.04 (1H, m), 7.81 (1H, dd,  $J=1.24$  Hz,  $J=7.84$  Hz), 7.64 (2H, d,  $J=8.04$  Hz), 7.54-7.60 (1H, m), 7.23-7.29 (1H, m), 7.18 (2H, d,  $J=7.80$  Hz), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

化合物 1 6 5 N-〔2-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル〕-ニコチンアミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 1 6 5 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  9.92 (1H, s), 9.29 (1H, s), 8.75–8.78 (2H, m), 8.30–8.40 (1H, m), 8.15 (1H, s), 7.55–7.65 (5H, m), 7.42–7.49 (2H, m), 7.15–7.25 (1H, m), 2.32 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

化合物 166 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 166 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

化合物 167 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 167 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

化合物 168 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 168 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437 (M-1)

化合物 169 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 169 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 435、437 (M-1)

化合物 170 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 170 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 451、452 (M-1)

化合物 171 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 171 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 525、527 (M-1)

化合物 172 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 172 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 441、442 (M-1)

化合物 173 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 173 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

化合物 174 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 174 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 435 (M-1)

化合物 175 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 175 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437、438 (M-1)

化合物 176 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 176 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 451、452 (M-1)

化合物 177 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 177 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 524、525 (M-1)

化合物 178 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エチルベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 178 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 466、468 (M-1)



化合物 179 N- [4-ブロモ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 179 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 466 (M-1)

化合物 180 N- [4-ブロモ-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 180 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462 (M-1)

化合物 181 N- [4-ブロモ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 181 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 462、464 (M-1)

化合物 182 N- [4-ブロモ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 182 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 476、478 (M-1)

化合物 183 N- [4-ブロモ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-エチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 183 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 550 (M-1)

化合物 184 N- [4-クロロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 184 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395、397 (M-1)

化合物 185 N- [4-クロロ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 185 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

化合物 186 N- [4-クロロ-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 186 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

化合物 187 N- [4-クロロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 187 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

化合物 188 N- [4-クロロ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 188 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405、407 (M-1)

化合物 189 N- [4-クロロ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 189 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 479、480 (M-1)

化合物 190 N- [4-クロロ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 190 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395、397 (M-1)

化合物 191 N- [4-クロロ-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 191 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

化合物 192 N- [4-クロロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 192 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

化合物 193 N- [4-クロロ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒ

ドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 193 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

化合物 194 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 194 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 479 (M-1)

#### 実施例 4

化合物 195 N-[4-ブロモ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

メチル 2-アミノ-5-プロモベンゾエート (化合物 A) (2.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (1.0 ml)、3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (2.0 g) をそれぞれ加え、同温度にて 3 時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-プロモ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (3.32 g, 収率 100%) を得た。

続いて、メチル 5-プロモ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (1.5 g) を、無水塩化メチレンに溶解させ、室温にてトリエチルアミン (2.0 ml)、4-メルカプトピリジン (化合物 B') (880 mg) を加え、同温度にて 12 時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣にジエチルエーテルを加え結晶化させ、結晶を桐山ロータ (φ 21 mm) を用いてろ過し、ジエチルエーテルを用いて洗浄し、有用中間体であるメチル 5-プロモ-2-(3-[ (4-ピリジルスルファニル) メチル] ベンゾイルアミノ) ベンゾエート (1.20 g, 収率 67%) を得た。

上記反応で得られた、メチル 5-ブロモ-2-(3-[(4-ピリジルスルファニル)メチル]ベンゾイルアミノ)ベンズエート (1.20 g) を、エタノール (25.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (2.0 ml) を加え、加熱還流下で1時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロート ( $\phi$  21 mm) を用いて濾過し、結晶をジエチルエーテルにて洗浄し、ヒドラジン化合物である N-(4-ブロモ-2-ヒドラジノカルボニルフェニル)-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド (753 mg、収率65.4%) を得た。

N-(4-ブロモ-2-ヒドラジノカルボニルフェニル)-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド (50.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて触媒量の酢酸、3-フルオロベンズアルデヒド (化合物C) (50.0  $\mu$ l) を添加し、加熱還流下にて1時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、氷冷下にて冷却し結晶を析出させた。析出した結晶を、桐山ロート ( $\phi$  21 mm) を用いて濾過し、結晶をトルエン、ヘキサンを用いて洗浄した。結晶を真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物 195 (27.0 mg、収率43.6%) を得た。

質量分析 (ESI-MS) 561、563 (M-1)

化合物 196 N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物 196 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

化合物 197 N-[4-ブロモ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物 197 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 198 N-[4-ブロモ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジ

ノカルボニル) -フェニル] - 3 - (ピリジン-4-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 198 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 199 N- [4-ブromo-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3 - (ピリジン-4-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 199 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 571 (M-1)

化合物 200 N- [4-ブromo-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3 - (ピリジン-4-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 200 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 647 (M-1)

化合物 201 N- [4-ブromo-2- (1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 201 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

化合物 202 N- [4-ブromo-2- (4, 5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] - 3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 202 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 499 (M-1)

化合物 203 N- [2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 203 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 40.0 MHz) :  $\delta$  8.92-8.98 (2H, m), 8.49 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 8.34-8.40 (2H,

m), 8.26 (1H, s), 8.81–8.87 (1H, m), 7.64 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.55–7.61 (1H, m), 7.25–7.31 (1H, m), 7.15–7.20 (2H, m), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 357 (M-1)

化合物 204 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 204 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 546 (M-1)

化合物 205 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 205 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 546 (M-1)

化合物 206 N-[4-ヨード-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 206 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

化合物 207 N-[4-ヨード-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 207 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

化合物 208 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 208 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 556 (M-1)

化合物 209 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-3,4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 209 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 630 (M-1)

化合物 210 N- [2- (1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 210 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 346 (M-1)

化合物 211 N- [4-ブromo-2- (1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 211 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 424 (M-1)

化合物 212 N- [4-クロロ-2- (1-メチル-1H-ピロール-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 212 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 380 (M-1)

化合物 213 N- {2- [1- (3-フルオロフェニル) -エチリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 213 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 434 (M-1)

化合物 214 N- {4-ブromo-2- [1- (3-フルオロフェニル) -エチリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 214 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 512、514 (M-1)

化合物 215 N- [4-ブromo-2- (1-m-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 215 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 449、451 (M-1)

化合物 216 N- [4-ブromo-2- (1-p-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 216 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 449 (M-1)

化合物 2 1 7 N- [4-クロロ-2- (1-p-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 1 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

化合物 2 1 8 N- [2- (4, 5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 1 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 2 1 9 N- [2- (4, 5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 1 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 2 2 0 N- [4-プロモ-2- (4, 5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

化合物 2 2 1 N- [4-プロモ-2- (4, 5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439、441 (M-1)

化合物 2 2 2 N- [4-クロロ-2- (4, 5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

化合物 2 2 3 N- [4-クロロ-2- (4, 5-ジメチル-フラン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

化合物 2 2 4 N- [2- (ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル]



ル]ーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 3 4 2 (M-1)

化合物 2 2 5 N- [2- (2-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 3 6 0 (M-1)

化合物 2 2 6 N- [2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 3 6 0 (M-1)

化合物 2 2 7 N- [2- (ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ー4, 5-ジメトキシフェニル]ー3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 4 6 2 (M-1)

化合物 2 2 8 N- [2- (2-ブロモベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 4 2 1 (M-1)

化合物 2 2 9 N- [2- (2-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ーベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 2 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 3 5 6 (M-1)

化合物 2 3 0 N- [4, 5-ジメトキシ-2- (2-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 4 7 6 (M-1)

化合物 2 3 1 N- [2- (2-クロロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

化合物 2 3 2 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(6-メトキシナフタレン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 482 (M-1)

化合物 2 3 3 N-[2-(ビフェニル-4-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 478 (M-1)

化合物 2 3 4 N-[2-(4-ブロモベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

化合物 2 3 5 N-[2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 368 (M-1)

化合物 2 3 6 2-フルオロ-N-[2-(2-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

化合物 2 3 7 2-フルオロ-N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 378 (M-1)

化合物 2 3 8 2-フルオロ-N-[2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 3 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 374 (M-1)

化合物 239 N-[2-(3-tert-ブチル-2-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-2-フルオロ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 239 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 432 (M-1)

化合物 240 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(4-ニトロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 240 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 447 (M-1)

化合物 241 N-[2-(4-ジエチルアミノ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 241 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 473 (M-1)

化合物 242 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヒドロキシ-フェニル]-3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 242 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 436、437 (M-1)

化合物 243 N-[4-ブロモ-2-(ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 243 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 483 (M-1)

化合物 244 N-[4-クロロ-2-(ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 244 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 437 (M-1)

化合物 245 3, 4-ジメトキシ-N-[2-(ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 245 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 403 (M-1)

化合物 246 N- [4-クロロ-2- (6-メチル-ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 246 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 451 (M-1)

化合物 247 3, 4-ジメトキシ-N- [2- (6-メチル-ピリジン-2-イルメチレン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 247 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 417 (M-1)

化合物 248 N- [4-ブromo-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4-tert-ブチル-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 248 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 490、492 (M-1)

化合物 249 N- [2- (1-m-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 249 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

化合物 250 N- [4-クロロ-2- (1-m-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 250 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

化合物 251 N- [2- (1-p-トルイル-エチリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 251 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

化合物 252 N- [4-ブromo-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ニコチンアミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 252 を製造した。

<sup>1</sup>H-NMR (MeOH-d<sub>4</sub>, 400MHz) : δ 9.21-9.25 (1H,

m), 8.79–8.93 (2H, m), 8.34–8.39 (1H, m), 8.25 (1H, s), 8.01 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 8.00–8.15 (1H, m), 7.71 (1H, dd,  $J=8.08\text{ Hz}$ ,  $J=2.20\text{ Hz}$ ), 7.63 (2H, d,  $J=8.32\text{ Hz}$ ), 7.18 (2H, d,  $J=8.08\text{ Hz}$ ), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 437、438 ( $M-1$ )

化合物 253 N-[2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 253 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.96–8.99 (2H, m), 8.49 (1H, d,  $J=8.08\text{ Hz}$ ), 8.42 (2H, dd,  $J=1.20\text{ Hz}$ ,  $J=5.60\text{ Hz}$ ), 8.27 (1H, s), 7.85 (1H, dd,  $J=1.20\text{ Hz}$ ,  $J=7.80\text{ Hz}$ ), 7.51–7.61 (3H, m), 7.18–7.31 (3H, m), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 357 ( $M-1$ )

化合物 255 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 255 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 563 ( $M-1$ )

化合物 256 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 256 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 563 ( $M-1$ )

化合物 257 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 257 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 258 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 258 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 259 N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 259 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 571 (M-1)

化合物 260 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 260 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 645、647 (M-1)

化合物 261 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 261 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

化合物 262 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 262 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

化合物 263 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 6 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 2 4 (M-1)

化合物 2 6 4 N- [4-プロモ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 6 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 2 6 (M-1)

化合物 2 6 5 N- [4-プロモ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 6 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 4 0 (M-1)

化合物 2 6 6 N- [4-プロモ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 6 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 6 1 2、6 1 4 (M-1)

化合物 2 6 7 N- [4-プロモ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (1H- [1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 2 6 7 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 60 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 31 (1H, s), 8. 28 (1H, bs), 8. 05 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 8. 01 (1H, m), 7. 86 (1H, m), 7. 73 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.2$  Hz), 7. 60 (2H, m), 7. 52 (1H, m), 7. 46 (1H, t,  $J=7.7$  Hz), 7. 19 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 4. 44 (2H, s), 2. 30 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 5 6 1 (M-1)

化合物 2 6 8 N- [4-プロモ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジ

ノカルボニル) -フェニル] - 3 - (1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物268を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  2.38 (3H, s), 4.44 (2H, s), 7.26 (1H, d,  $J=7.4\text{Hz}$ ), 7.46 (2H, m), 7.59 (1H, m), 7.66 (1H, dd,  $J=9.0\text{Hz}$ ,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.72 (1H, m), 7.86 (2H, m), 7.97-8.05 (2H, m), 8.29-8.34 (2H, m), 8.57 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

化合物269 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物269を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz) :  $\delta$  2.48-2.53 (3H, m), 4.43 (2H, s), 7.27-7.82 (9H, m), 7.96 (3H, m), 8.57 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 549 (M-1)

化合物270 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物270を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  4.44 (2H, s), 7.20 (1H, m), 7.45 (1H, m), 7.59 (1H, m), 7.66 (1H, dd,  $J=9.0\text{Hz}$ ,  $J=2.3\text{Hz}$ ), 7.75 (1H, dd,  $J=9.0\text{Hz}$ ,  $J=2.3\text{Hz}$ ), 7.87 (2H, m), 7.99-8.06 (3H, m), 8.30 (1H, s), 8.36 (1H, s), 8.57 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 553 (M-1)

化合物271 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラ



ジノカルボニル) -フェニル] - 3 - (1H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 271 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  4.44 (2H, s), 7.19 (1H, m), 7.45 (2H, m), 7.59-7.77 (3H, m), 7.86 (2H, m), 7.97-8.01 (2H, m), 8.29-8.36 (2H, m), 8.58 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 553 (M-1)

化合物 272 N - [4-ブromo-2 - (4-クロロ-3-トリフルオロメチル - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 3 - (1H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 272 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  4.44 (2H, s), 7.45 (1H, m), 7.59 (1H, m), 7.67 (1H, m), 7.76 (1H, dd,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.85 (2H, m), 7.97-8.06 (3H, m), 8.29 (1H, s), 8.39 (1H, s), 8.57 (1H, dd,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $J=1.7\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 635 (M-1)

化合物 273 N - [4-ブromo-2 - (3, 4-ジメチル - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 4 - (3-ヒドロキシ - プロピルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 273 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (2H, m), 2.31 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.50 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 3.60 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.80 (2H, s), 7.20 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.52 (3H, m), 7.66 (1H, s), 7.74 (1H, dd,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.96 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ) 8.30 (1H, s), 8.63 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 552 (M-1)

化合物 274 N-[4-ブromo-2-(4-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 274 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (2H, m), 2.39 (3H, s), 2.50 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.60 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.80 (2H, s), 7.27 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.52 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.74 (3H, m), 7.96 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 8.01 (1H, m), 8.33 (1H, s), 8.63 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 538 (M-1)

化合物 275 N-[4-ブromo-2-(3-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 275 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.51 (2H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 3.60 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 7.25-7.35 (2H, m), 7.52 (2H, m), 7.63 (1H, m), 7.71-7.77 (2H, m), 7.96 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.62 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 538 (M-1)

化合物 276 N-[4-ブromo-2-(4-フルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 276 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (2H, m), 2.51 (2H, m), 3.60 (2H, m), 3.81 (2H, m), 7.19 (2

H, m), 7.51 (2H, m), 7.75–8.06 (6H, m), 8.35 (1H, m), 8.60 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

化合物 277 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 277 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.76 (2H, m), 2.51 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.60 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 7.19 (1H, m), 7.46–7.54 (3H, m), 7.60 (1H, m), 7.70 (1H, m), 7.77 (1H, dd,  $J=9.1\text{ Hz}$ ,  $J=2.3\text{ Hz}$ ), 7.96 (2H, m), 8.07 (1H, s), 8.35 (1H, s), 8.62 (1H, d,  $J=9.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 542 (M-1)

化合物 278 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 278 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.76 (2H, m), 2.50 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.60 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.80 (2H, s), 7.52 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.69 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.76 (1H, dd,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.95 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.05–8.07 (2H, m), 8.33 (1H, s), 8.39 (1H, s), 8.62 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 626 (M-1)

#### 実施例 5

化合物 279 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[(2-モルホリン-4-イル)エチ

ルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート (化合物A) (3.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2.1 ml)、4-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (2.2 ml) をそれぞれ加え、同温度にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-ブロモ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエートを製造した (4.90 g, 収率100%)。

上記反応で得られた、メチル 5-ブロモ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (500 mg) を、無水塩化メチレン (3.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (545  $\mu$ l)、4-(2-アミノエチル) モルホリン (化合物B') (341  $\mu$ l) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体であるメチル 5-ブロモ-2-[(3-{[(2-モルホリノエチル) アミノ] メチル} ベンゾイル) アミノ] ベンゾエートを製造した (306 mg, 収率50%)。

上記反応で得られた、メチル 5-ブロモ-2-[(3-{[(2-モルホリノエチル) アミノ] メチル} ベンゾイル) アミノ] ベンゾエートを、エタノール (5.0 ml) に溶解させ、ヒドラジン-水和物 (650  $\mu$ l) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮し、ヒドラジン化合物 N-(4-ブロモ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニル) -3-[ (2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミドを製造した (220 mg, 粗収率75%)。

N-(4-ブロモ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニル) -3-[ (2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド (25 mg) を、

無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて触媒量の酢酸、3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物C) (10.0  $\mu$ l) を添加し、室温にて15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物279を製造した (21.1 mg、収率67%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.31 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.44 (4H, m), 2.60 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.97 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.65 (4H, t,  $J=4.6$  Hz), 4.15 (2H, s), 7.20 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.54 (1H, m), 7.59–7.70 (3H, m), 7.76 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.2$  Hz), 8.30 (2H, m), 8.07 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 8.32 (1H, s), 8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 594 ( $M+1$ )

化合物280 N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチルーアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物280を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.12 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.27 (6H, s), 2.28 (3H, s), 2.60 (2H, t,  $J=7.3$  Hz), 2.77 (4H, q,  $J=7.3$  Hz), 2.88 (2H, t,  $J=7.3$  Hz), 3.63 (2H, s), 7.16 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.50 (3H, m), 7.61 (1H, s), 7.70 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.2$  Hz), 7.97 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 8.02 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 8.30 (1H, s), 8.61 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 594 ( $M+1$ )

化合物281 N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン4-イル-エチル

アミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物281を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.43 (4H, m), 2.54 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 2.72 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 3.70 (4H, t,  $J=4.6\text{Hz}$ ), 3.89 (2H, s), 7.18 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.44-7.70 (6H, m), 7.99 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 8.31 (1H, s), 8.55 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 592 ( $M+1$ )

化合物282 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物282を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.39 (3H, s), 2.43 (4H, m), 2.53 (2H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ ), 2.72 (2H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ ), 3.70 (4H, t,  $J=4.6\text{Hz}$ ), 3.89 (2H, s), 7.23 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.56 (1H, m), 7.70 (3H, m), 7.99 (2H, m), 8.34 (1H, s), 8.56 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 576 ( $M-1$ )

化合物283 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物283を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.38 (3H, s), 2.43 (4H, m), 2.52 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 2.70 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 3.70 (4H, t,  $J=4.4\text{Hz}$ ), 3.88 (2H, s), 7.22-7.32 (2H, m), 7.44 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.52 (2H, m), 7.69 (2H, s), 8.00 (2H, d,  $J$

= 7.8 Hz), 8.42 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

化合物 284 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 284 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$ , 2.43 (4H, m), 2.52 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.70 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 3.70 (4H, t,  $J=4.5$  Hz), 3.89 (2H, s), 7.12 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.54 (1H, m), 7.67 (1H, m), 7.82 (2H, m), 8.00 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.39 (1H, s), 8.48 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 582 (M-1)

化合物 285 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 285 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.21 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.51-2.66 (8H, m), 3.55 (2H, s), 7.18 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.43 (3H, m), 7.66 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.74 (1H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.36 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.49 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 576 (M-1)

化合物 286 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 286 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.$

1 Hz), 2.23 (3H, s), 2.40 (3H, s), 2.52–2.66 (8H, m), 3.59 (2H, s), 7.24–7.33 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.56 (2H, m), 7.70 (2H, m), 8.00 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.38 (1H, s), 8.50 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 578 ( $M-1$ )

化合物 287 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 287 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.23 (3H, s), 2.54–2.66 (8H, m), 3.59 (2H, s), 7.12 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.54 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.83 (2H, m), 7.99 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.42 (1H, s), 8.47 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 580 ( $M-1$ )

化合物 288 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 288 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.22 (3H, s), 2.52–2.66 (8H, m), 3.58 (2H, s), 7.10 (1H, m), 7.34–7.46 (4H, m), 7.55 (2H, m), 7.68 (1H, s), 7.99 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.29 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.52 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 582 ( $M-1$ )

化合物 289 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノ)-メチル]-メチル}-ベンズアミド



ルアミノエチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 289 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.23 (3H, s), 2.53–2.66 (8H, m), 3.60 (2H, s), 7.48 (3H, m), 7.58 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.67 (1H, s), 7.98–8.07 (4H, m), 8.56 (1H, m), 8.52 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 664 ( $M-1$ )

化合物 290 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 290 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.21 (3H, s), 2.51–2.66 (8H, m), 3.56 (2H, s), 3.80 (3H, s), 6.89 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.43 (3H, m), 7.71 (3H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.38 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.45 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 594 ( $M-1$ )

化合物 291 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ジエチルアミノエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 291 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.21 (3H, s), 2.51–2.65 (8H, m), 3.56 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.94 (1H, m), 7.27–7.48 (6H, m), 7.75 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.41 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.47 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 592 ( $M-1$ )

化合物 292 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒ

ドラジノカルボニル) -フェニル] - 4 - [ (2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物292を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.57-2.73 (8H, m), 3.87 (3H, s), 7.18 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.43-7.73 (6H, m), 7.99 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.31 (1H, s), 8.56 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 576 ( $M-1$ )

化合物293 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル] - 4 - [ (2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物293を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.39 (3H, s), 2.56-2.73 (8H, m), 3.87 (2H, s), 7.22-7.27 (2H, m), 7.44 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.57-7.71 (4H, m), 7.99 (2H, m), 8.34 (1H, s), 8.59 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 562 ( $M-1$ )

化合物294 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル] - 4 - [ (2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物294を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.39 (3H, s), 2.52-2.70 (8H, m), 3.87 (2H, s), 7.23-7.33 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.55 (2H, m), 7.70 (2H, m), 8.00 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.38 (1H, s), 8.51 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 562 (M-1)

化合物 295 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 295 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.55-2.72 (8H, m), 3.87 (2H, s), 7.12 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.56-7.82 (4H, m), 7.99 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.39 (1H, s), 8.55 (1H, d,  $J=8.6$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

化合物 296 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 296 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.53-2.71 (8H, m), 3.88 (2H, s), 7.13 (1H, m), 7.37-7.71 (7H, m), 7.99 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.42 (1H, s), 8.49 (1H, d,  $J=8.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

化合物 297 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 297 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (3H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.24 (3H, m), 2.53-2.75 (6H, m), 3.72 (2H, m), 3.87 (2H, s), 7.46 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.56 (3H, m), 7.73 (1H, m), 7.98 (3H, m), 8.06 (1H, s), 8.48 (1H, d,  $J=8.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 650 (M-1)

化合物 298 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 298 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.55-2.72 (8H, m), 3.85 (3H, s), 3.87 (2H, s), 6.93 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.44 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.58 (1H, m), 7.75 (3H, m), 7.99 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.31 (1H, s), 8.60 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

化合物 299 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 299 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.52-2.70 (8H, m), 3.86 (3H, s), 3.87 (2H, s), 6.97 (1H, m), 7.29-7.45 (5H, m), 7.56 (1H, s), 7.73 (1H, m), 7.99 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.39 (1H, s), 8.53 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

化合物 300 4-({3-[ビス-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-プロピルアミノ}-メチル)-N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 300 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.73 (2H, m), 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.61 (6H, m), 2.73 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 3.60 (4H, m), 3.89 (2H, s), 7.

1.8 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.53 (3H, m), 7.64 (1H, s), 7.71 (1H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=2.4$  Hz), 7.98–8.05 (3H, m), 8.29 (1H, s), 8.60 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 626 ( $M+1$ )

化合物 301 4-({3-[ビス-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-プロピルアミノ}-メチル)-N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 301 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.74 (2H, m), 2.63 (6H, m), 2.75 (2H, m), 3.61 (4H, m), 3.90 (2H, s), 7.17 (1H, m), 7.45 (1H, m), 7.33–7.72 (5H, m), 7.89 (2H, m), 8.09 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 8.35 (1H, s), 8.60 (1H, d,  $J=8.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 612 ( $M-1$ )

化合物 302 4-({3-[ビス-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-プロピルアミノ}-メチル)-N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 302 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.75 (2H, m), 2.63 (6H, m), 2.78 (2H, m), 3.61 (4H, m), 3.91 (2H, s), 7.54 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.66 (2H, m), 8.00 (3H, m), 8.11 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 8.32 (1H, s), 8.38 (1H, s), 8.58 (1H, d,  $J=8.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 696 ( $M-1$ )

化合物 303 4-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 303 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (3H, s), 1.13 (3H, s), 2.29 (6H, m), 2.45–2.65 (4H, m), 3.60–3.99 (4H, m), 7.18 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.47 (3H, m), 7.55 (1H, m), 7.64 (1H, s), 7.70 (1H, s), 8.01 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.31 (1H, s), 8.52 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 595 ( $M-1$ )

化合物 304 4- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-プロモ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 304 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, m), 2.34 (3H, s), 2.42–2.62 (4H, m), 3.59–3.93 (4H, m), 7.19 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.44 (3H, m), 7.68 (3H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.41 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 579 ( $M-1$ )

化合物 305 N- [4-プロモ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [4- (2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 305 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.26 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.49 (8H, m), 3.16 (2H, s), 3.49–3.70 (10H, m), 7.15 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.40–7.52 (4H, m), 7.62 (1H, s), 7.73 (1H, s), 7.96 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.38 (1H, s), 8.49 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 673 ( $M-1$ )

化合物 306 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 306 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.50 (8H, m), 3.15 (2H, s), 3.49-3.75 (10H, m), 7.42 (2H, m), 7.54 (2H, m), 7.71 (1H, s), 7.99 (4H, m), 8.44 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.51 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 747 (M-1)

化合物 307 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 307 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.48 (8H, m), 3.16 (2H, s), 3.48-3.75 (10H, m), 3.81 (3H, s), 6.89 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.39 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, m), 7.69-7.53 (3H, m), 7.96 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.40 (1H, s), 8.49 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 675 (M-1)

化合物 308 4-[1, 4']-ピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 308 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.47 (2H, m), 1.65 (6H, m), 1.82 (2H, m), 1.94 (2H, t,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 2.24 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.55-2.68 (5H, m), 2.87 (2H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 3.47 (2H, s),

7. 13 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 36 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 43 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 50 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7. 59 (1H, s), 7. 88 (1H, s), 7. 96 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8. 43 (1H, s), 8. 53 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 630 (M-1)

化合物 309 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 309 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 47 (2H, m), 1. 59-1. 73 (6H, m), 1. 82 (2H, m), 1. 93 (2H, m), 2. 34 (3H, s), 2. 57-2. 69 (5H, m), 2. 87 (2H, d,  $J=11.5$  Hz), 3. 47 (2H, s), 7. 19 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 36 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 51 (1H, m), 7. 66 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 87 (1H, s), 7. 96 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8. 45 (1H, s), 8. 53 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 614 (M-1)

化合物 310 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 310 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 47 (2H, m), 1. 59-1. 74 (6H, m), 1. 83 (2H, m), 1. 94 (2H, m), 2. 35 (3H, s), 2. 59-2. 75 (5H, m), 2. 87 (2H, d,  $J=11.5$  Hz), 3. 47 (2H, s), 7. 19 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 26 (1H, m), 7. 36 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7. 51 (2H, m), 7. 64 (1H, s), 7. 90 (1H, s), 7. 95 (2



H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 8.46 (1H, s), 8.54 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 614 ( $M-1$ )

化合物 311 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブロモ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 311 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.47 (2H, m), 1.60-1.75 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.93 (2H, m), 2.56-2.74 (5H, m), 2.87 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 3.47 (2H, s), 7.06 (2H, t,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.36 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.74 (2H, m), 7.87-8.00 (3H, m), 8.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 620 ( $M-1$ )

化合物 312 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブロモ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 312 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.47 (2H, m), 1.59-1.75 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.94 (2H, m), 2.50-2.70 (5H, m), 2.87 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 3.48 (2H, s), 7.08 (1H, m), 7.30-7.40 (3H, m), 7.50 (3H, m), 7.87 (1H, s), 7.95 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 8.49 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 620 ( $M-1$ )

化合物 313 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 313 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.50 (2H, m), 1.60–1.80 (6H, m), 1.82–1.96 (4H, m), 2.62–2.78 (5H, m), 2.86 (2H, d,  $J=11.0\text{Hz}$ ), 3.46 (2H, s), 7.35 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.51 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.94 (5H, m), 8.50 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.57 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 702 ( $M-1$ )

化合物 314 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 314 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.47 (2H, m), 1.59–1.75 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.94 (2H, m), 2.60–2.76 (5H, m), 2.87 (2H, d,  $J=11.5\text{Hz}$ ), 3.46 (2H, s), 3.79 (3H, s), 6.88 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.35 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.52 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.68 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, s), 7.95 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 8.41 (1H, s), 8.55 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 632 ( $M-1$ )

化合物 315 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 315 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.47 (2H, m), 1.58–1.80 (6H, m), 1.83 (2H, m), 1.92 (2H, m), 2.59–2.75 (5H, m), 2.85 (2H, m), 3.45 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.91 (1H, d,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 7.20–7.40 (5H, m), 7.52 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.94 (3H,

m), 8.49 (1H, s), 8.56 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 632 (M-1)

化合物 316 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 316 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.48-2.65 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.64 (2H, t,  $J=5.2$  Hz), 7.18 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.46 (3H, m), 7.57 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.64 (1H, s), 7.70 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.29 (1H, s), 8.56 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

化合物 317 N-[4-ブromo-2-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 317 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.40 (3H, s), 2.54-2.75 (10H, m), 3.60 (2H, s), 3.68 (2H, m), 7.25 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.62 (1H, m), 7.70 (3H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.28 (1H, s), 8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 576 (M-1)

化合物 318 N-[4-ブromo-2-(3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 318 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.40 (3H, s), 2.50-2.67 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.64 (2H, t,  $J$

= 5.3 Hz), 7.24 (1H, m), 7.32 (1H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.56 (2H, m), 7.70 (2H, m), 7.99 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 8.53 (1H, d,  $J=9.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 578 (M-1)

化合物 319 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 319 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  2.48-2.70 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.65 (2H, t,  $J=5.2$  Hz), 7.12 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.53 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.82 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.40 (1H, s), 8.46 (1H, d,  $J=8.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 580 (M-1)

化合物 320 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 320 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  2.50-2.75 (10H, m), 3.60 (2H, s), 3.69 (2H, t,  $J=5.2$  Hz), 7.14 (1H, m), 7.36-7.72 (7H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.39 (1H, s), 8.50 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 582 (M-1)

化合物 321 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 321 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.50–2.72 (10H, m), 3.60 (2H, s), 3.66 (2H, t,  $J=5.2\text{Hz}$ ), 7.15 (1H, m), 7.43–7.72 (6H, m), 7.99 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 8.07 (1H, s), 8.46 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 664 ( $M-1$ )

化合物 322 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 322 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.50–2.70 (10H, m), 3.58 (2H, s), 3.65 (2H, t,  $J=5.2\text{Hz}$ ), 3.85 (3H, s), 6.94 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.44 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.59 (1H, m), 7.69–7.80 (3H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 8.28 (1H, s), 8.60 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 594 ( $M-1$ )

化合物 323 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 323 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.45–2.65 (10H, m), 3.57 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=5.4\text{Hz}$ ), 3.86 (3H, s), 6.98 (1H, m), 7.17 (1H, m), 7.22–7.58 (5H, m), 7.71 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 8.38 (1H, s), 8.50 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 592 ( $M-1$ )

化合物 324 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 324 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.61 (2H, m), 1.86–2.24 (4H, m), 2.89 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.75 (2H, m), 3.57 (2H, s), 3.71 (1H, m), 7.18 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.45 (3H, m), 7.55 (1H, m), 7.64 (1H, s), 7.69 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.54 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 563 ( $M-1$ )

化合物 325 N-[4-ブromo-2-(4-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4-(4-ヒドロキシーピペリジンー1-イルメチル)ーベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 325 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.60 (2H, m), 1.89 (2H, m), 2.17 (2H, m), 2.39 (3H, s), 2.74 (2H, m), 3.56 (2H, m), 3.71 (1H, s), 7.15–7.27 (2H, m), 7.44 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.56 (1H, m), 7.69 (3H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.32 (1H, s), 8.55 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 549 ( $M-1$ )

化合物 326 N-[4-ブromo-2-(3-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4-(4-ヒドロキシーピペリジンー1-イルメチル)ーベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 326 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.60 (2H, m), 1.90 (2H, m), 2.17 (2H, m), 2.40 (3H, s), 2.74 (2H, m), 3.56 (2H, m), 3.71 (1H, m), 7.24–7.34 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.58 (2H, m), 7.70 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.31 (1H, s), 8.57 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

化合物 327 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 327 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.59 (2H, m), 1.89 (2H, m), 2.17 (2H, m), 2.74 (2H, m), 3.56 (2H, s), 3.72 (1H, m), 7.13 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.56 (1H, m), 7.66 (1H, s), 7.82 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.36 (1H, s), 8.51 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

化合物 328 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 328 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.65 (2H, m), 1.93 (2H, m), 2.30 (2H, m), 2.80 (2H, m), 3.65 (2H, s), 3.75 (1H, m), 7.15 (1H, m), 7.26-7.69 (7H, m), 7.99 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 8.54 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

化合物 329 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 329 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.58 (2H, m), 1.91 (2H, m), 2.38 (2H, m), 2.75 (2H, m), 3.58 (2H, s), 3.71 (1H, m), 7.16 (1H, m), 7.47 (2H, d,

$J=8.1\text{ Hz}$ ),  $7.52-7.75$  (4H, m),  $7.98$  (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ),  $8.24$  (1H, s),  $8.58$  (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 635 (M-1)

化合物 330 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 330 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{ MHz}$ ):  $\delta$  1.62 (2H, m), 1.90 (2H, m), 2.20 (2H, m), 2.75 (2H, m), 3.59 (2H, s), 3.72 (1H, m), 3.86 (3H, s), 6.95 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.62-7.80 (4H, m), 7.98 (2H, m), 8.21 (1H, s), 8.70 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

化合物 331 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 331 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{ MHz}$ ):  $\delta$  1.60 (2H, m), 1.90 (2H, m), 2.17 (2H, m), 2.75 (2H, m), 2.57 (2H, s), 2.72 (1H, m), 3.87 (3H, s), 6.99 (1H, m), 7.25-7.77 (7H, m), 7.97 (2H, d,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.63 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

化合物 332 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチルピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 332 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{ MHz}$ ):  $\delta$  1.25-1.76 (5H,



m), 2.03 (2H, m), 2.28 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.91 (2H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.3$  Hz), 3.58 (2H, s), 7.17 (1H, m), 7.41–7.72 (6H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.32 (1H, s), 8.53 (1H, d,  $J=8.5$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 575 (M-1)

化合物 333 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 333 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.20–1.76 (5H, m), 2.04 (2H, m), 2.39 (3H, s), 2.93 (2H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.4$  Hz), 3.60 (2H, s), 7.24 (2H, m), 7.42–7.76 (6H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.33 (1H, s), 8.58 (1H, d,  $J=8.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 561 (M-1)

化合物 334 N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 334 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.20–2.15 (7H, m), 2.38 (3H, s), 2.93 (2H, m), 3.40–3.65 (4H, m), 7.20–7.32 (1H, m), 7.40–7.70 (6H, m), 8.27 (1H, s), 8.65 (1H, d,  $J=8.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

化合物 335 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 335 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.20–1.40 (5H, m), 1.72 (2H, m), 2.93 (2H, m), 3.47–3.65 (4H, m), 7.12 (2H, m), 7.40–7.88 (6H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 8.47 (1H, s), 8.54 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 567 (M-1)

化合物 336 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 336 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.20–1.80 (5H, m), 2.05 (2H, m), 2.93 (2H, m), 3.42–3.65 (4H, m), 7.12 (1H, m), 7.24–7.66 (6H, m), 7.82 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

化合物 337 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 337 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.20–2.22 (7H, m), 2.92 (2H, m), 3.39–3.65 (4H, m), 7.14–8.10 (9H, m), 8.32 (1H, s), 8.64 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 649 (M-1)

化合物 338 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 338 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.20–1.76 (5H, m), 2.03 (2H, m), 2.91 (2H, m), 3.46–3.64 (4H, m), 3.84 (3H, s), 6.93 (2H, m), 7.41–7.80 (6H, m), 7.97 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.32 (1H, s), 8.55 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 579 ( $M-1$ )

化合物 339 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 339 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.20–2.25 (7H, m), 2.95 (2H, m), 3.45–3.67 (4H, m), 3.87 (3H, s), 6.80–7.80 (8H, m), 7.95 (2H, m), 8.25 (1H, s), 8.65 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 577 ( $M-1$ )

化合物 340 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 340 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.15 (2H, m), 1.35 (3H, m), 1.61 (2H, m), 1.92 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.77 (2H, m), 3.42 (2H, m), 3.52 (2H, s), 7.24 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.48 (3H, m), 7.55 (1H, s), 7.80 (1H, dd,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.88 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.09 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 8.38 (1H, s), 8.52 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 589 ( $M-1$ )

実施例 6

化合物 3 4 1 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (1H- [1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って得られた化合物 2 7 1 : N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (1H- [1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル) -ベンズアミド (100 mg) を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、3-クロロパーオキシベンゾイックアシッド (32 mg) を加え室温で 2 時間攪拌した。得られた結晶をろ過し、塩化メチレン、ヘキサンで洗浄し表題化合物 3 4 1 を製造した (76 mg、収率 70%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  4.65 (2H, m), 7.29 (1H, m), 7.53 (4H, m), 7.83 (3H, m), 8.08 (1H, d,  $J=2.0$  Hz), 8.43 (2H, m), 8.83 (1H, s), 11.72 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 569 ( $M-1$ )

化合物 3 4 2 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 3 4 2 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.07 (6H, m), 2.30 (12H, m), 2.56 (8H, m), 3.61 (2H, s), 7.18 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.30-7.60 (6H, m), 7.93 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.01 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 532 ( $M-1$ )

化合物 3 4 3 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [4-メチル-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフエン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って表題の化合物 3 4 3 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.$

1 Hz), 2.26 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.51–2.80 (8H, m), 3.60 (2H, s), 7.21 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.30–7.80 (6H, m), 7.93 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.00 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

化合物 344 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 344 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.25 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.52–2.70 (8H, m), 3.60 (2H, s), 7.35–7.60 (5H, m), 7.80 (1H, m), 7.92 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.00 (2H, d,  $J=3.9$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 606 (M-1)

化合物 345 3-[1, 4']-ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 345 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.44 (2H, m), 1.50–2.10 (12H, m), 2.30 (10H, m), 2.57 (2H, m), 2.96 (2H, d,  $J=11.7$  Hz), 3.56 (2H, s), 7.17 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.30–7.55 (6H, m), 7.92 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.99 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 570 (M-1)

化合物 346 N-[4-ブromo-2-(3-フェニル-アリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 346 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.15 (1H, s), 8.73–8.78 (1H, m), 8.54 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.26–8.42 (1H, m), 8.17 (1H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.77 (1H, dd,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.55–7.64 (3H, m), 7.30–7.42 (3H, m), 7.05–7.10 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 447 ( $M-1$ )

化合物 347 N-[4-ブromo-2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 347 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.75–8.00 (2H, m), 8.57 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.28 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 8.05–8.08 (1H, m), 7.92–7.95 (2H, m), 7.78 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.57 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.30–7.42 (3, m), 7.05–7.10 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 447 ( $M-1$ )

化合物 348 N-[4-クロロ-2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 348 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.14–9.18 (1H, m), 8.75 (1H, dd,  $J=4.9\text{ Hz}$ ,  $J=1.5\text{ Hz}$ ), 8.59 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, ddd,  $J=1.4\text{ Hz}$ ,  $J=1.4\text{ Hz}$ ,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.17 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.55–7.65 (4H, m), 7.30–7.42 (3H, m), 7.05–7.10 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 403 ( $M-1$ )

化合物 349 N-[4-クロロ-2-(3-フェニルアリリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 349 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (2H, dd,  $J=1.7$  Hz,  $J=4.4$  Hz), 8.62 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.18 (1H, dd,  $J=1.4$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.93–7.97 (3H, m), 7.64 (1H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.55–7.60 (2H, m), 7.31–7.43 (3H, m), 7.06–7.12 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 403 ( $M-1$ )

化合物 350 N- {4-ブromo-2- [3- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 350 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (2H, dd,  $J=1.7$  Hz,  $J=4.4$  Hz), 8.57 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.31 (1H, s), 8.08 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.95 (2H, dd,  $J=1.7$  Hz,  $J=4.6$  Hz), 7.81 (1H, s), 7.77–7.79 (1H, m), 7.76 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.03 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 4.11 (2H, t,  $J=9.5$  Hz), 3.89 (2H, t,  $J=9.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 481 ( $M-1$ )

化合物 351 N- {4-クロロ-2- [3- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 351 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (2H, dd,  $J=1.7$  Hz,  $J=4.6$  Hz), 8.63 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.31 (1H, s), 7.93–7.97 (3H, m), 7.79 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.64 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.03 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 4.11 (2H, t,  $J=4.8$  Hz), 3.89 (2H, t,  $J=4.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 437 ( $M-1$ )

化合物 352 N- {4-ブロモ-2- [3- (2-メトキシフェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 352 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.15 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 8.75 (1H, dd,  $J=1.4$  Hz,  $J=4.9$  Hz), 8.39 (1H, ddd,  $J=1.8$  Hz,  $J=1.8$  Hz,  $J=7.8$  Hz), 8.16 (1H, d,  $J=9.2$  Hz), 8.06 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.77 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.56-7.65 (2H, m), 7.30-7.40 (2H, m), 7.11 (1H, dd,  $J=9.5$  Hz,  $J=6.1$  Hz), 7.02 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 6.97 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz), 3.90 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 480 ( $M-1$ )

化合物 353 N- {4-ブロモ-2- [3- (2-メトキシフェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 353 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.76-8.80 (2H, m), 8.57 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.17 (1H, d,  $J=9.5$  Hz), 8.07 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.94 (2H, dd,  $J=1.7$  Hz,  $J=4.4$  Hz), 7.78 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=8.9$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=6.4$  Hz), 7.30-7.41 (2H, m), 6.95-7.24 (3H, m), 3.90 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 480 ( $M-1$ )

化合物 354 N- {4-クロロ-2- [3- (2-メトキシフェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 354 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.16 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 8.76 (1H, dd,  $J=2.1$  Hz,  $J=5.3$  Hz), 8.60 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.35-8.42 (1H, m), 8.16 (1H, d,  $J=9.5$  Hz), 7.92 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.



5.8–7.65 (3H, m), 7.30–7.41 (2H, m), 7.11 (1H, dd,  $J=9.5\text{ Hz}$ ,  $J=16.1\text{ Hz}$ ), 7.02 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 6.97 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.90 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 433 (M-1)

化合物 355 N- {4-クロロ-2- [3- (2-メトキシフェニル) -アリリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -イソニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 355 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (2H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 8.63 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.17 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 7.92–7.98 (3H, m), 7.55–7.70 (2H, m), 7.30–7.38 (2H, m), 7.07–7.17 (1H, m), 6.95–7.05 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 435 (M-1)

化合物 356 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド 塩酸塩

実施例 3 に記載の方法に従って、表題の化合物 356 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 473 (M-1)

化合物 357 N- [4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(3-フルオロフェニルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 357 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.59 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.05–8.08 (1H, m), 7.93 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.60–7.80 (4H, m), 7.51 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 6.80–7.40 (5H, m), 4.27 (2H, s), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 574 (M-1)

化合物 358 N- { 2 - [ 3 - ( 4 - ジメチルアミノ - フェニル ) - アリリデン - ヒドラジノカルボニル ] - フェニル } - ニコチンアミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 358 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.17 (1H, s,  $J=1.5$  Hz), 8.75 (1H, dd,  $J=1.5$  Hz,  $H=4.9$  Hz), 8.60 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 8.38-8.44 (1H, m), 8.11 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.85 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.60-7.65 (2H, m), 7.42 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.29 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.94-7.00 (1H, m), 6.80-6.88 (1H, m), 6.74 (2H, d,  $J=9.0$  Hz), 3.00 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 412 ( $M-1$ )

化合物 359 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 359 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.79 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.73 (1H, d,  $J=5.1$  Hz), 8.33 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.98-8.04 (1H, m), 7.89 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.73 (1H, d,  $J=10.0$  Hz), 7.58-7.66 (3H, m), 7.42-7.50 (1H, m), 7.15-7.22 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 395 ( $M-1$ )

化合物 360 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 360 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.72 (1H, d,  $J=4.9$  Hz), 8.33 (1H, s), 8.

2.2 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.01 (1H, ddd,  $J=7.8$  Hz,  $J=7.8$  Hz,  $J=1.4$  Hz), 7.89–7.95 (2H, m), 7.88 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.58–7.65 (2H, m), 7.19 (2H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=8.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 395 (M-1)

化合物 361 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 361 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.73 (1H, d,  $J=4.6$  Hz), 8.31 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.98–8.04 (1H, m), 7.88 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.72 (1H, s), 7.56–7.66 (3H, m), 7.24–7.35 (2H, m), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

化合物 362 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 362 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.73 (1H, d,  $J=4.9$  Hz), 8.30 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.01 (1H, ddd,  $J=8.5$  Hz,  $J=8.5$  Hz,  $J=1.7$  Hz), 7.87 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.75 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.57–7.64 (2H, m), 7.27 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 391 (M-1)

化合物 363 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 363 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.77 (1H, d,  $J=9.$

0 Hz), 8.73 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 8.27 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.00 (1H, d d d,  $J=1.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.87 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.67 (1H, s), 7.53–7.64 (3H, m), 7.20 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 405 (M-1)

化合物 364 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 1 に記載の方法に従って、表題の化合物 364 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.79 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.71–8.75 (1H, m), 8.35–8.40 (2H, m), 8.22 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.07 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.98–8.04 (1H, m), 7.90 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.70 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.58–7.67 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 479 (M-1)

化合物 366 N-{4-クロロ-2-[N'-(3,4-ジメチル-ベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-3-(ピリジン-4-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 366 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 529, 531, 532 (M-1)

#### 実施例 7

化合物 367 N-{4-ブロモ-2-[N'-(4-メチル-ベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 1 に記載の方法に従って得られた化合物 62 : N-[4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド (100 mg) をテトラヒドロフラン/メタノール=4/1 の混合溶液 (2.0 ml) に溶解させ、室温にて水素化ホウ素ナトリウム

(14.0 mg) を添加した。同温度にて30分攪拌し、TLCにて反応終了を確認後、蒸留水(2.0 ml)を注加した。クロロホルムを用いて分液抽出し、有機相を硫酸ナトリウムにて乾燥させた後、減圧下にて濃縮した。得られた、残渣をプレパラティブTLCにて精製し、表題の化合物367(42.2 mg)を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.35 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87–7.95 (4H, m), 7.63 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.62 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.19 (2H, dd,  $J=8.8$  Hz), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t,  $J=5.9$  Hz), 2.71 (4H, t,  $J=5.9$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 496, 497, 498, 499 (M-1)

化合物368 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物368を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.35 (1H, s), 7.89–7.98 (3H, m), 7.70 (1H, d,  $J=9.8$  Hz), 7.57–7.64 (3H, m), 7.42–7.50 (2H, m), 7.10–7.23 (1H, m), 3.62 (2H, s), 2.99 (2H, d,  $J=12.0$  Hz), 2.59 (4H, bs), 2.29–2.39 (1H, m), 2.06 (2H, t,  $J=11.5$  Hz), 1.86 (2H, d,  $J=11.7$  Hz), 1.55–1.68 (6H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 574, 576 (M-1)

化合物369 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物369を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 7.88–7.97 (5H, m), 7.56–7.64 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.15–7.22 (2H, m), 3.62 (2H, s), 3.98 (2H, d,  $J=12.2\text{Hz}$ ), 2.57 (4H, bs), 2.25–2.35 (1H, m), 2.05 (2H, t,  $J=11.1\text{Hz}$ ), 1.80–1.90 (2H, m), 1.53–1.66 (7H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 574, 576 ( $M-1$ )

化合物 370 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 370 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.53 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.88–7.98 (4H, m), 7.71 (1H, s), 7.57–7.65 (3H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.25–7.37 (2H, m), 3.63 (2H, s), 3.99 (2H, d,  $J=12.0\text{Hz}$ ), 2.56 (4H, bs), 2.39 (3H, s), 2.25–2.37 (1H, m), 2.06 (2H, t,  $J=11.3\text{Hz}$ ), 1.80–1.90 (2H, m), 1.55–1.64 (6H, m), 1.40–1.49 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 570, 571 ( $M-1$ )

化合物 371 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 371 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.89–7.98 (3H, m), 7.74 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.57–7.64 (2H, m), 7.52

(1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.27 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.63 (2H, s), 2.95–3.05 (2H, m), 2.56 (4H, bs), 2.39 (3H, s), 2.25–2.35 (1H, m), 2.00–2.10 (2H, m), 1.80–1.90 (2H, m), 1.59 (6H, bs), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 570, 571 (M-1)

化合物 372 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 372 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.89–7.95 (2H, m), 7.65 (1H, s), 7.49–7.68 (4H, m), 7.20 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, s), 2.99 (2H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.55 (4H, bs), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.25–2.30 (1H, m), 2.01–2.10 (2H, m), 1.80–1.88 (2H, m), 1.54–1.65 (6H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 584, 585 (M-1)

化合物 373 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 373 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 8.05 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.89–7.98 (4H, m), 7.71 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.64 (1H, dd,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.56–7.62 (1H, m), 7.53 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.66 (2H, s), 3.00–3.10 (6H, m), 2.09–2.18 (3H,

m), 1.96–2.03 (2H, m), 1.70–1.80 (6H, m), 1.55–1.65 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 658, 660 (M-1)

化合物 374 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 374 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.62 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.32 (1H, s), 7.87–7.98 (4H, m), 7.47–7.65 (4H, m), 7.28–7.38 (2H, m), 6.97–7.03 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.61 (3H, s), 2.97 (2H, d,  $J=10.5$  Hz), 2.55 (4H, bs), 2.25–2.35 (1H, m), 1.97–2.10 (2H, m), 1.80–1.88 (2H, m), 1.54–1.65 (6H, m), 1.44 (2H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 586, 588 (M-1)

化合物 375 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 375 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.30 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.89–7.94 (2H, m), 7.79 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.57–7.64 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.85 (3H, s), 3.62 (2H, s), 3.99 (2H, d,  $J=12.0$  Hz), 2.56 (4H, bs), 2.25–2.35 (1H, m), 2.05 (2H, t,  $J=11.0$  Hz), 1.80–1.90 (2H, m), 1.55–1.65 (6H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 586, 587 (M-1)



化合物 376 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 376 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.89–7.98 (4H, m), 7.62 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.32 (1H, s), 7.20–7.30 (2H, m), 6.85–6.90 (1H, m), 3.64 (2H, s), 3.02 (2H, d,  $J=11.7$  Hz), 2.66 (4H, bs), 2.32 (1H, bs), 2.08 (2H, t,  $J=11.4$  Hz), 1.85–1.93 (2H, m), 1.52–1.68 (6H, m), 1.40–1.51 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 572, 574 ( $M-1$ )

化合物 377 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 377 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.26 (1H, s), 7.96 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.70 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.62 (2H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.57–7.63 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 6.84 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 3.63 (2H, s), 2.99 (2H, d,  $J=12.0$  Hz), 2.57 (4H, bs), 2.27–2.36 (1H, m), 2.06 (2H, t,  $J=11.2$  Hz), 1.85 (2H, d,  $J=12.7$  Hz), 1.52–1.67 (6H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 572, 574, 575 ( $M-1$ )

化合物 378 4-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-

{4-ブromo-2-[N'-(3-メトキシベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-フェニル}-ベンズアミド

実施例7に記載の方法に従って、表題の化合物378を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 632, 634 (M-1)

化合物379 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物379を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.35 (1H, s), 7.90-8.00 (2H, m), 7.89 (1H, s), 7.70 (1H, d,  $J=9.8$  Hz), 7.56-7.63 (3H, m), 7.53 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz), 7.43-7.49 (1H, m), 3.67 (2H, s), 2.69-2.75 (2H, m), 2.54-2.64 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 536, 538 (M-1)

化合物380 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物380を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.35 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.87-7.93 (3H, m), 7.58-7.64 (2H, m), 7.53 (1H, dd,  $J=7.4$  Hz,  $J=7.4$  Hz), 7.19 (2H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.68-2.74 (2H, m), 2.53-2.63 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 536, 538 (M-1)

化合物381 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

ノカルボニル) -フェニル] -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物381を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.89-7.96 (2H, m), 7.71 (2H, s), 7.58-7.65 (2H, m), 7.53 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.25-7.35 (2H, m), 3.67 (2H, s), 2.67-2.75 (2H, m), 2.51-2.62 (6H, m), 2.39 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.01 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 532, 534 ( $M-1$ )

化合物382 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物382を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.73 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.58-7.63 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.26 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 3.67 (2H, s), 2.68-2.74 (2H, m), 2.53-2.63 (6H, m), 2.38 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 532, 534 ( $M-1$ )

化合物383 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物383を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.89-7.95

(2H, m), 7.66 (1H, s), 7.58–7.64 (2H, m), 7.50–7.57 (2H, m), 7.20 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.68–2.75 (2H, m), 2.54–2.63 (6H, m), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.29 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 546, 548 ( $M-1$ )

化合物 384 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 384 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.38 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.95–8.00 (2H, m), 7.92 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.68 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.57–7.64 (2H, m), 7.53 (1H, s), 3.66 (2H, s), 2.71–2.79 (2H, m), 2.54–2.66 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 620, 622 ( $M-1$ )

化合物 385 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 385 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.89–7.96 (2H, m), 7.49–7.63 (4H, m), 7.27–7.37 (2H, m), 6.95–7.05 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.67–2.73 (2H, m), 2.53–2.62 (6H, m), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 548, 550 ( $M-1$ )

化合物 386 N- [4-クロロ-2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 386 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.30 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.79 (2H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.58-7.64 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.84 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.67-2.73 (2H, m), 2.52-2.62 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 548, 550 ( $M-1$ )

化合物 387 N- [4-クロロ-2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 387 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.61 (2H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.53 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.21-7.34 (3H, m), 6.85-6.90 (1H, ddd,  $J=2.2$  Hz,  $J=2.2$  Hz,  $J=6.8$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.70-2.75 (2H, m), 2.54-2.64 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 534, 536 ( $M-1$ )

化合物 388 N- [4-クロロ-2- (4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 388 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.27 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.88–7.95 (2H, m), 7.70 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.61 (2H, dd,  $J=1.8\text{Hz}$ ,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.53 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 6.84 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 3.68 (2H, s), 2.76 (2H, t,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 2.55–2.68 (6H, m), 2.29 (3H, s), 1.04 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 534, 536 ( $M-1$ )

化合物 389 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 389 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 506 ( $M-1$ )

化合物 390 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 390 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 506 ( $M-1$ )

化合物 391 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 391 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503, 504 ( $M-1$ )

化合物 392 N-[4-クロロ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(1H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 4 に記載の方法に従って、表題の化合物 392 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503, 504 ( $M-1$ )

化合物 393 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル

ーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3ー(1Hー[1, 2, 4] トリアゾールー3ーイルスルファニルメチル)ーベンズアミド

実施例4に記載の方法に従って、表題の化合物393を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 591, 593 (M-1)

化合物394 Nー[4ークロロー2ー(3ーフルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3ー{ [(2ーヒドロキシーエチル)ーメチルーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物394を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 8.00 (1H, s), 7.88ー7.95 (2H, m), 7.71 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 7.58ー7.67 (3H, m), 7.53 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.42ー7.50 (1H, m), 7.15ー7.22 (1H, m), 3.69ー3.74 (4H, m), 2.62 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 481, 483 (M-1)

化合物395 Nー[4ークロロー2ー(4ーフルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3ー{ [(2ーヒドロキシーエチル)ーメチルーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物395を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 7.95ー8.02 (2H, m), 7.87ー7.95 (3H, m), 7.63 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.19 (2H, dd,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.69ー3.75 (4H, m), 2.62 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 481, 483 (M-1)

化合物396 Nー[4ークロロー2ー(3ーメチルーベンジリデンーヒドラジ

ノカルボニル) -フェニル] - 3 - { [(2-ヒドロキシ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物396を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.88-7.95 (3H, m), 7.71 (1H, s), 7.60-7.65 (3H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.25-7.36 (2H, m), 3.68-3.74 (4H, m), 2.61 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.39 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477 ( $M-1$ )

化合物397 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物397を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.00 (1H, bs), 7.90-7.95 (2H, m), 7.74 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.60-7.65 (2H, m), 7.53 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.27 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.70-3.78 (4H, m), 2.65 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.38 (3H, s), 2.32 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477 ( $M-1$ )

化合物398 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物398を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.00 (1H, bs), 7.90-7.95 (2H, m), 7.66 (1H, s), 7.59-7.65 (2H, m), 7.



5.0–7.57 (2H, m), 7.20 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 3.76 (2H, s), 3.73 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.66 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.33 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 491 (M-1)

化合物 399 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 399 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.39 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.03–8.08 (1H, m), 8.00 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.90 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.70 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.58–7.67 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 3.68–3.74 (4H, m), 2.60 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

化合物 400 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 400 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.58–7.64 (2H, m), 7.57 (1H, s), 7.48–7.54 (1H, m), 7.26–7.36 (2H, m), 6.97–7.02 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.68–3.74 (4H, m), 2.61 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 495 (M-1)

化合物 401 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラ

ジノカルボニル) - フェニル] - 3 - { [(2-ヒドロキシ-エチル) - メチル - アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 401 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.31 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.75-7.93 (5H, m), 7.58-7.65 (2H, m), 7.53 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.00 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.85 (3H, s), 3.67-3.74 (4H, m), 2.63 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.31 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 494 ( $M-1$ ).

化合物 402 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 3 - { [(2-ヒドロキシ-エチル) - メチル - アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 402 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.88-7.94 (3H, m), 7.62 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.31 (1H, bs), 7.23-7.28 (2H, m), 3.68-3.74 (4H, m), 2.61 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479 ( $M-1$ )

化合物 403 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 3 - { [(2-ヒドロキシ-エチル) - メチル - アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 403 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.27 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.89-7.94 (3H, m), 7.71 (2H, d,  $J=8.7$  Hz), 7.58-7.65 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.

8.4 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 3.71 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.70 (2H, s), 2.61 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 481 ( $M-1$ )

化合物 404 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 404 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.67 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.34 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.90 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.74 (1H, s), 7.61-7.66 (3H, m), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.25-7.37 (2H, m), 3.83 (2H, s), 3.66 (4H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 2.71 (4H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507, 509 ( $M-1$ )

化合物 405 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 405 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 507, 508 ( $M-1$ )

化合物 406 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 406 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.67 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.92 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.87-7.91 (1H, m), 7.68 (1H, s), 7.60-7.65 (2H, m), 7.47-7.58 (2H, m), 7.20

(1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 2.71 (4H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 521, 522 ( $M-1$ )

化合物 407 3- { [ビス- (2-ヒドロキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 407 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 8.37 (1H, s), 8.05-8.10 (2H, m), 7.95 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.84-7.92 (1H, m), 7.70 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.60-7.68 (2H, m), 7.48-7.53 (1H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 2.71 (4H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 595, 597 ( $M-1$ )

化合物 408 3- { [ビス- (2-ヒドロキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 408 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.89-7.96 (2H, m), 7.58-7.66 (3H, m), 7.48-7.54 (1H, m), 7.28-7.38 (2H, m), 6.97-7.04 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.66 (4H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 2.72 (4H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 523, 525 ( $M-1$ )

化合物 409 3- { [ビス- (2-ヒドロキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカル

ボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物409を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.31 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.80-7.94 (4H, m), 7.60-7.66 (2H, m), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.00 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 3.90 (3H, s), 3.85 (2H, s), 3.66 (4H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ ), 2.71 (4H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 523, 525 ( $M-1$ )

化合物410 3- { [ビス- (2-ヒドロキシーエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物410を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 8.05 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.87-7.92 (1H, m), 7.60-7.66 (2H, m), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.33 (1H, s), 7.26 (2H, d,  $J=4.9\text{Hz}$ ), 6.85-6.92 (1H, m), 3.83 (2H, s), 3.66 (4H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ ), 2.71 (4H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 509 ( $M-1$ )

化合物411 3- { [ビス- (2-ヒドロキシーエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物411を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.67 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.27 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.85-7.93 (2H, m), 7.72 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.60-7.65 (2H, m), 7.47-7.54 (1H, m), 6.85 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ )

6 Hz), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t,  $J=5.9$  Hz), 2.71 (4H, t,  $J=5.9$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 509, 511 ( $M-1$ )

化合物 412 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 412 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.36 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.94 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.68-7.74 (1H, m), 7.58-7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.43-7.50 (1H, m), 7.10-7.23 (1H, m), 3.69 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 482 ( $M-1$ )

化合物 413 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 413 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.36 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.87-7.95 (3H, m), 7.63 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.55 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.19 (2H, dd,  $J=8.7$  Hz,  $J=8.7$  Hz), 3.69 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 481, 483 ( $M-1$ )

化合物 414 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 1 4 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.93 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.72 (1H, s), 7.60-7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.26-7.36 (2H, m), 3.69 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.40 (3H, s), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477, 479 ( $M-1$ )

化合物 4 1 5 N-[4-クロロ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 1 5 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.93 (1H, d,  $J=2.5$  Hz), 7.74 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.62 (1H, dd,  $J=2.5$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.55 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.27 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 3.69 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.67 (3H, s), 2.58 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.39 (3H, s), 2.27 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 477 ( $M-1$ )

化合物 4 1 6 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 1 6 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.30 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.92 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.66 (1H, s), 7.61 (1H,

dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.52–7.57 (3H, m), 7.20 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 3.69 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 3.67 (2H, s), 2.58 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.27 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 491, 493 ( $M-1$ )

化合物 417 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 417 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.25 (1H, s), 7.93–7.98 (1H, m), 7.83–7.90 (3H, m), 7.60 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.54 (1H, dd,  $J=2.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.46 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 3.59 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 3.58 (2H, s), 2.49 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.18 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 565, 567 ( $M-1$ )

化合物 418 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 418 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.24 (1H, s), 7.82–7.90 (3H, m), 7.42–7.55 (4H, m), 7.18–7.27 (2H, m), 6.88–6.94 (1H, m), 3.77 (3H, s), 3.56–3.61 (4H, m), 2.50 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.18 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 495 ( $M-1$ )

化合物 419 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチル



ーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 1 9 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.21 (1H, s), 7.88 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.81 (1H, d,  $J=2.2\text{Hz}$ ), 7.69 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=2.4\text{Hz}$ ,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 6.89 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 3.75 (3H, s), 3.59 (2H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 3.59 (2H, s), 2.50 (2H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 2.19 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493, 495 ( $M-1$ )

化合物 4 2 0 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチルーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 2 0 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.19 (1H, s), 7.88 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.82-7.85 (1H, m), 7.50-7.55 (1H, m), 7.46 (2H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.22 (1H, s), 7.13-7.18 (2H, m), 6.75-6.82 (1H, m), 3.56-3.62 (4H, m), 2.49 (2H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 2.19 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 479, 481 ( $M-1$ )

化合物 4 2 1 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[(2-ヒドロキシエチル)-メチルーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 2 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 479, 481 ( $M-1$ )

化合物 4 2 2 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチルー(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 2 2 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.26 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.84 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.78–7.83 (1H, m), 7.33–7.70 (6H, m), 7.05–7.20 (1H, m), 3.72 (2H, s), 3.57 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.59 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.54 (3H, q,  $J=7.3$  Hz), 1.02 (3H, t,  $J=7.1$  Hz)  
質量分析 (ESI-MS) 495 ( $M-1$ )

化合物 4 2 3 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 2 3 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.54 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.26 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.77–7.85 (4H, m), 7.53 (2H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.41 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.09 (2H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 3.68 (2H, s), 3.57 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 2.57 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.53 (2H, q,  $J=7.1$  Hz), 1.01 (3H, t,  $J=7.2$  Hz)  
質量分析 (ESI-MS) 495 ( $M-1$ )

化合物 4 2 4 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 2 4 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.24 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.83 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.78–7.82 (1H, m), 7.62 (1H, s), 7.53 (2H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.42 (2H, dd,  $J=7.4$  Hz,  $J=7.4$  Hz), 7.15–7.26 (2H, m),

3. 69 (2H, s), 3. 57 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2. 57 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2. 53 (2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2. 30 (3H, s), 1. 01 (3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 491 ( $M-1$ ), 515 ( $M+23$ )

化合物 425 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 425 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8. 33 (1H, s), 8. 01 (1H, s), 7. 88-7. 94 (2H, m), 7. 74 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7. 60-7. 65 (2H, m), 7. 51 (2H, m), 7. 26 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 3. 80 (2H, s), 3. 67 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2. 69 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2. 64 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2. 38 (3H, s), 1. 11 (3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 491 ( $M-1$ ), 515 ( $M+23$ )

化合物 426 N-[4-クロロ-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 426 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 66 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8. 30 (1H, s), 8. 02 (1H, s), 7. 89-7. 94 (2H, m), 7. 60-7. 69 (3H, m), 7. 49-7. 57 (2H, m), 7. 21 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3. 82 (2H, s), 3. 68 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2. 70 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2. 66 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2. 32 (3H, s), 2. 30 (3H, s), 1. 12 (3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 505 ( $M-1$ )

化合物 427 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル

ーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3ー{[エチルー(2ーヒドロキシーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物427を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 579 (M-1)

化合物428 Nー[4ークロロー2ー(3ーメトキシーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3ー{[エチルー(2ーヒドロキシーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物428を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.89 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.56ー7.66 (3H, m), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.29ー7.37 (2H, m), 6.97ー7.04 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.77 (2H, s), 3.66 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.66 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 2.61 (2H, q,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

化合物429 Nー[4ークロロー2ー(4ーメトキシーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3ー{[エチルー(2ーヒドロキシーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物429を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.91 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.87ー7.91 (1H, m), 7.80 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.59ー7.65 (2H, m), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 6.99 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.85 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.66 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.67 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.62 (2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

化合物 430 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチルー(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 430 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.29 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.89 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.60-7.66 (2H, m), 7.51 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.22-7.40 (3H, m), 3.78 (2H, s), 3.66 (2H, t,  $J=6.4$  Hz), 2.67 (2H, t,  $J=6.4$  Hz), 2.62 (2H, q,  $J=7.3$  Hz), 1.10 (3H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

化合物 431 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[エチルー(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 431 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.27 (1H, s), 8.00 (1H, s), 7.86-7.94 (2H, m), 7.70 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.58-7.65 (2H, m), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.84 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 3.77 (2H, s), 3.66 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.66 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.62 (2H, q,  $J=7.2$  Hz), 1.10 (3H, t,  $J=7.1$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

化合物 432 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチルー(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 432 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.36 (1H, s), 7.92–8.00 (3H, m), 7.71 (1H, d,  $J=9.5\text{Hz}$ ), 7.54–7.65 (4H, m), 7.43–7.51 (1H, m), 7.15–7.23 (1H, m), 3.75 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=6.2\text{Hz}$ ), 2.64 (2H, t,  $J=6.2\text{Hz}$ ), 2.60 (2H, q,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 1.09 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 495 ( $M-1$ )

化合物 433 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 433 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 7.96 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.87–7.94 (3H, m), 7.61 (1H, dd,  $J=2.4\text{Hz}$ ,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.55 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.19 (2H, dd,  $J=8.8\text{Hz}$ ,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 3.74 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=6.2\text{Hz}$ ), 2.64 (2H, t,  $J=6.3\text{Hz}$ ), 2.60 (2H, q,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 1.09 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 495 ( $M-1$ )

化合物 434 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 434 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.93 (1H, d,  $J=2.4\text{Hz}$ ), 7.12 (1H, s), 7.60–7.65 (2H, m), 7.56 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.25–7.36 (2H, m), 3.74 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=6.2\text{Hz}$ ),

2. 64 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2. 60 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2. 40 (3H, s), 1. 09 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 491 (M-1)

化合物 435 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 435 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 66 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8. 33 (1H, s), 7. 97 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7. 92 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7. 89 (1H, s), 7. 74 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7. 61 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7. 27 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 3. 77 (2H, s), 3. 64 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2. 67 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2. 63 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2. 38 (3H, s), 1. 10 (3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 491 (M-1)

化合物 436 N-[4-クロロ-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシ-エチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 436 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 66 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8. 30 (1H, s), 7. 97 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7. 92 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7. 52-7. 68 (5H, m), 7. 20 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3. 77 (2H, s), 3. 64 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2. 67 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2. 63 (2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2. 32 (3H, s), 2. 31 (3H, s), 1. 10 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

化合物 437 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル

ーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4ー{[エチルー(2ーヒドロキシーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物437を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.05 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.93–7.98 (2H, m), 7.89 (1H, s), 7.70 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.63 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.56 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ); 3.75 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 2.64 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 2.60 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.09 (3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 579 ( $M-1$ )

化合物438 Nー[4ークロロー2ー(3ーメトキシーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4ー{[エチルー(2ーヒドロキシーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物438を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.92–7.99 (3H, m), 7.62 (1H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.54–7.60 (3H, m), 7.28–7.37 (2H, m), 6.98–7.04 (1H, m), 3.87 (3H, s), 3.74 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.64 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.60 (2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 1.09 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 507 ( $M-1$ )

化合物439 Nー[4ークロロー2ー(4ーメトキシーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー4ー{[エチルー(2ーヒドロキシーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物439を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.$



0 Hz), 8.31 (1H, s), 7.96 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.92 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.80 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.61 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.56 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.85 (3H, s), 3.74 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=6.4$  Hz), 2.65 (2H, t,  $J=6.4$  Hz), 2.60 (2H, q,  $J=7.2$  Hz), 1.09 (3H, t,  $J=7.1$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 507 ( $M-1$ )

化合物 440 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 440 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.88-7.99 (3H, m), 7.62 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.56 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.30-7.33 (1H, m), 7.23-7.27 (2H, m), 6.85-6.91 (1H, m), 3.75 (2H, s), 3.63 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.65 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 2.61 (2H, q,  $J=7.1$  Hz), 1.09 (3H, t,  $J=7.1$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 493 ( $M-1$ )

化合物 441 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[エチル-(2-ヒドロキシエチル)-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 441 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.27 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.91 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.70 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.61 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.56 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 6.85 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.78 (2

H, s), 3.64 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.68 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.64 (2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 1.10 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 493 ( $M-1$ )

化合物 442 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 442 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.36 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.94 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.71 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.58-7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.43-7.50 (1H, m), 7.15-7.25 (1H, m), 3.85 (2H, s), 2.60-2.67 (2H, m), 2.50-2.59 (6H, m), 1.00 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 539 ( $M-1$ )

化合物 443 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 443 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.88-7.95 (3H, m), 7.62 (1H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.19 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 3.85 (1H, s), 2.49-2.67 (8H, m), 1.00 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 539 ( $M-1$ )

化合物 444 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニル

メチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 4 4 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.93 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.72 (1H, s), 7.60–7.65 (2H, m), 7.55 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.25–7.36 (2H, m), 3.84 (2H, s), 2.48–2.66 (8H, m), 2.39 (3H, s), 1.00 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 535 ( $M-1$ )

化合物 4 4 5 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 4 5 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.93 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.74 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.61 (1H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.55 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.27 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 3.84 (2H, s), 2.47–2.66 (8H, m), 2.39 (3H, s), 1.00 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 535 ( $M-1$ )

化合物 4 4 6 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 4 6 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.96 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.91 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.65 (1H, s), 7.60 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.51–7.56 (3H, m),

7. 19 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 3. 83 (2H, s), 2. 58–2. 65 (2H, m), 2. 48–2. 58 (6H, m), 2. 31 (3H, s), 2. 29 (3H, s), 0. 99 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 549 (M-1)

化合物 447 N- [4-クロロ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 447 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 39 (1H, s), 8. 35 (1H, s), 8. 05 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 93–7. 99 (3H, m), 7. 70 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 63 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7. 55 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 3. 85 (2H, s), 2. 50–2. 68 (8H, m), 1. 00 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 623 (M-1)

化合物 448 N- [4-クロロ-2- (3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 448 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 33 (1H, s), 7. 92–8. 00 (3H, m), 7. 63 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7. 59 (1H, s), 7. 55 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 28–7. 38 (2H, m), 6. 98–7. 03 (1H, m), 3. 88 (3H, s), 3. 84 (2H, s), 2. 58–2. 66 (2H, m), 2. 47–2. 58 (6H, m), 0. 99 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

化合物 449 N- [4-クロロ-2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- (2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

ルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 4 9 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.31 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.92 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.80 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.61 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.55 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.00 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.85 (3H, s), 3.84 (2H, s), 2.49–2.67 (8H, m), 1.00 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 551 ( $M-1$ )

化合物 4 5 0 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 5 0 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.93 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.62 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 7.55 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.31 (1H, s), 7.22–7.28 (2H, m), 6.83–6.91 (1H, m), 3.85 (2H, s), 2.57–2.66 (2H, m), 2.48–2.57 (6H, m), 1.00 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 537 ( $M-1$ )

化合物 4 5 1 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 4 5 1 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.27 (1H, s), 7.96 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.91 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.71 (2H, d,  $J=8.6$  Hz),

7. 61 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7. 55 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 6. 84 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3. 84 (2H, s), 2. 49–2. 66 (8H, m), 1. 00 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 537 (M-1)

化合物 452 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 452 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8. 36 (1H, s), 7. 93–7. 99 (2H, m), 7. 89 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7. 70 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7. 52–7. 65 (3H, m), 7. 41–7. 56 (2H, m), 7. 15–7. 23 (1H, m), 3. 88 (2H, s), 2. 42–2. 66 (8H, m), 0. 96 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 539 (M-1)

化合物 453 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 453 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 65 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8. 36 (1H, s), 7. 85–7. 99 (5H, m), 7. 57–7. 65 (2H, m), 7. 47–7. 55 (1H, m), 7. 12–7. 23 (2H, m), 3. 88 (2H, s), 2. 46–2. 65 (8H, m), 0. 96 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 539 (M-1)

化合物 454 N-[4-クロロ-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 454 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.89 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.71 (1H, s), 7.59–7.66 (3H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.24–7.35 (2H, m), 3.88 (2H, s), 2.46–2.65 (8H, m), 2.39 (3H, s), 0.96 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 535 ( $M-1$ )

化合物 455 N-[4-クロロ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 455 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.84–7.95 (2H, m), 7.73 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.58–7.65 (2H, m), 7.51 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.26 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 3.88 (2H, s), 2.46–2.66 (8H, m), 2.38 (3H, s), 0.96 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 535 ( $M-1$ )

化合物 456 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 456 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.30 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.87–7.94 (2H, m), 7.58–7.67 (3H, m), 7.48–7.56 (2H, m), 7.19 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 3.88 (2H, s), 2.46–2.67 (8H, m), 2.31 (3H, s), 2.29 (3H, s), 0.

96 (6H, q,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 549 ( $M-1$ )

化合物 457 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 457 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.40 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.04 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.93-8.00 (2H, m), 7.89 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.69 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.60-7.65 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 3.88 (2H, s), 2.58-2.67 (2H, m), 2.47-2.58 (6H, m), 0.97 (6H, t,  $J=7.1$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 623 ( $M-1$ )

化合物 458 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 458 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.87-7.91 (1H, m), 7.59-7.65 (2H, m), 7.57 (1H, s), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.28-7.37 (2H, m), 6.97-7.03 (1H, m), 3.87 (2H, s), 3.86 (3H, s), 2.46-2.65 (8H, m), 0.96 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 551 ( $M-1$ )

化合物 459 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド



実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 459 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.31 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.92 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.89 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.79 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.59–7.65 (2H, m), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.88 (2H, s), 3.84 (3H, s), 2.46–2.66 (8H, m), 0.96 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 551 ( $M-1$ )

化合物 460 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 460 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 537 ( $M-1$ )

化合物 461 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 461 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.27 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.91 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.89 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.70 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.58–7.65 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.8$  Hz,  $J=7.8$  Hz), 6.84 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 3.88 (2H, s), 2.46–2.65 (8H, m), 0.96 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 537 ( $M-1$ )

化合物 462 N-[4-クロロ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 462 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.62 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.36 (1H, s), 8.03 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.88–7.93 (2H, m), 7.69 (1H, d,  $J=10.0$  Hz), 7.58–7.65 (3H, m), 7.42–7.52 (2H, m), 7.19 (1H, ddd,  $J=2.0$  Hz,  $J=8.4$  Hz,  $J=8.4$  Hz), 4.63 (2H, s), 4.33 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.67 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 579, 581 ( $M-1$ )

化合物 463 N-[4-クロロ-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 463 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.62 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.36 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.87–7.94 (4H, m), 7.59–7.65 (2H, m), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.19 (2H, dd,  $J=8.7$  Hz,  $J=8.7$  Hz), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.67 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 579 ( $M-1$ )

化合物 464 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 464 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.70 (1H, s), 7.59–7.64 (3H, m), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.25–7.36 (2H, m), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, s), 2.66 (2H,

t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 2.39 (3H, s), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 575 ( $M-1$ )

化合物 465 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 465 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.73 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.61 (2H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.27 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.67 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.38 (3H, s), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 575 ( $M-1$ )

化合物 466 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 466 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.89-7.95 (2H, m), 7.59-7.68 (3H, m), 7.54 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.21 (1H, d), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.66 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 589, 591 ( $M-1$ )

化合物 467 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-

## ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物467を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.60 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 8.31 (1H, s), 8.02–8.07 (2H, m), 7.93 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.89 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.69 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.62 (2H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.44 (1H, s), 2.67 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 663 ( $M-1$ )

化合物468 N-[4-クロロ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物468を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.34 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.91 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.60–7.66 (2H, m), 7.57 (1H, s), 7.49 (1H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.28–7.38 (2H, m), 6.98–7.04 (1H, m), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.86 (3H, s), 3.44 (1H, s), 2.67 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 591 ( $M-1$ )

化合物469 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物469を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ),

0 Hz), 8.31 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.79 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.58–7.64 (2H, m), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 3.84 (3H, s), 3.45 (1H, s), 2.67 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.18 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 591 (M-1)

化合物 470 N-[4-クロロ-2-(3-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 470 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.62 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.29 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.89–7.95 (2H, m), 7.55–7.65 (2H, m), 7.48 (1H, dd,  $J=7.8$  Hz,  $J=7.8$  Hz), 7.31 (1H, s), 7.22–7.29 (2H, m), 6.86–6.90 (1H, m), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, s), 2.67 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.17 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

化合物 471 N-[4-クロロ-2-(4-ヒドロキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-[1-(2-ジメチルアミノ-エチル)-1H-テトラゾール-5-イルスルファニルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 471 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.27 (1H, s), 8.04 (1H, s), 7.87–7.93 (2H, m), 7.69 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.57–7.63 (2H, m), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.84 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 4.63 (2H, s), 4.32 (2H, t,  $J=6.4$  Hz), 2.67 (2H, t,  $J=6.4$  Hz), 2.17 (6

H, s)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

化合物 472 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -  
メチル} -N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)  
-4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 472 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.36 (1H, s), 8.23 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.68 (1H, d,  $J=9.5$  Hz), 7.42-7.63 (5H, m), 7.18 (1H, dd,  $J=8.4$  Hz,  $J=8.4$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.78 (2H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.65 (4H, q,  $J=7.2$  Hz), 2.58 (2H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.28 (3H, s), 1.04 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 628 (M-1)

化合物 473 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -  
メチル} -N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)  
-4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 473 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.36 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=1.9$  Hz), 7.86-7.99 (5H, m), 7.60 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 7.18 (2H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.77 (2H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.64 (4H, q,  $J=7.2$  Hz), 2.58 (2H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.28 (3H, s), 1.04 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 628 (M-1)

化合物 474 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -  
メチル} -N- [4-ヨード-2- (3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカ

ルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物474を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.45 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=1.1\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 7.88-7.93 (2H, m), 7.69 (1H, s), 7.58-7.63 (2H, m), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.32 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.25 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.66 (2H, s), 2.67-2.73 (2H, m), 2.52-2.61 (6H, m), 2.38 (3H, s), 2.27 (3H, s), 1.01 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 624 ( $M-1$ )

化合物475 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [4-ヨード-2- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物475を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 7.89-7.94 (2H, m), 7.72 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.26 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.67 (2H, s), 2.75 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.62 (4H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.57 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.37 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 624 ( $M-1$ )

化合物476 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物476を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.20 (1H, d,  $J=2.0\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 7.90 (2H, dd,  $J=2.0\text{Hz}$ ,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.58–7.66 (2H, m), 7.48–7.56 (2H, m), 7.19 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 3.66 (2H, s), 2.68–2.75 (2H, m), 2.53–2.64 (6H, m), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 638 ( $M-1$ )

化合物 477 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨード-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 477 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.43 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.38 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.25 (1H, s), 8.02 (1H, d,  $J=.6\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.67 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6\text{Hz}$ ,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 3.66 (2H, s), 2.75 (2H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 2.62 (4H, q,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 2.56 (2H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 2.27 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 712 ( $M-1$ )

化合物 478 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[4-ヨード-2-(3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 478 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=2.0\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.60 (1H, d,  $J$



= 7.6 Hz), 7.56 (1H, bs), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.22–7.36 (2H, m), 6.97–7.03 (1H, m), 3.86 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.71 (2H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.53–2.62 (6H, m), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 640 ( $M-1$ )

化合物 479 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [4-ヨード-2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 479 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.45 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.31 (1H, s), 8.20 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.97 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.78 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.84 (3H, s), 3.67 (2H, s), 2.73 (2H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.60 (4H, q,  $J=7.2$  Hz), 2.54–2.60 (2H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 640 ( $M-1$ )

化合物 480 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (3-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 480 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.29 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=2.0$  Hz), 7.97 (1H, s), 7.88–7.94 (2H, m), 7.60 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.30 (1H, s), 7.20–7.28 (2H, m), 6.87 (1H, ddd,  $J=2.2$  Hz,  $J=2.2$  Hz,  $J=7.1$  Hz), 3.66 (2H,

s), 2.72 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.59 (4H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.56 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.27 (3H, s), 1.02 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 626 (M-1)

化合物 481 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-ヒドロキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 481 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.45 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.27 (1H, s), 8.19 (1H, d,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 7.88-7.95 (2H, m), 7.69 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 6.83 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 3.67 (2H, s), 2.75 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.62 (4H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.75-2.64 (2H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 626 (M-1)

化合物 482 3- [1, 4'] ビピペリジンイル-1' -イルメチル-N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ヨード-フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 482 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.36 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.87-7.97 (4H, m), 7.42-7.72 (4H, m), 7.14-7.23 (1H, m), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.60 (4H, bs), 2.30-2.40 (1H, m), 2.05 (2H, t,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 1.82-1.91 (2H, m), 1.55-1.66 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 666 (M-1)

化合物 483 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 483 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.43 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.35 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=2.0$  Hz), 7.85-7.97 (5H, m), 7.58 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.18 (2H, dd,  $J=8.7$  Hz,  $J=8.7$  Hz), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d,  $J=12.0$  Hz), 2.59 (4H, bs), 2.25-2.38 (1H, m), 2.05 (2H, t,  $J=11.5$  Hz), 1.85 (2H, d,  $J=12.7$  Hz), 1.54-1.66 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 666 ( $M-1$ )

化合物 484 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ヨード-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 484 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.34 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=1.9$  Hz), 7.88-7.97 (3H, m), 7.68 (1H, s), 7.55-7.64 (2H, m), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.21-7.34 (2H, m), 3.60 (2H, s), 2.97 (2H, d,  $J=10.8$  Hz), 2.54 (4H, bs), 2.38 (3H, s), 2.25-2.35 (1H, m), 2.25-2.35 (1H, m), 2.03 (2H, t,  $J=11.7$  Hz), 1.83 (2H, d,  $J=12.4$  Hz), 1.50-1.65 (6H, m), 1.38-1.48 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 662 ( $M-1$ )

化合物 485 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-

[4-ヨード-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物485を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.87-7.97 (3H, m), 7.72 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.26 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 2.55 (4H, bs), 2.37 (3H, s), 2.23-2.35 (1H, m), 2.05 (2H, t,  $J=11.7\text{ Hz}$ ), 1.84 (2H, d,  $J=12.0\text{ Hz}$ ), 1.53-1.66 (6H, m), 1.40-1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 662 ( $M-1$ )

化合物486 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物486を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 8.19 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.87-7.96 (3H, m), 7.62 (1H, s), 7.57 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.51 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.15-7.22 (1H, m), 3.60 (2H, s), 2.92-3.02 (2H, m), 2.52 (4H, bs), 2.29 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.20-2.33 (1H, m), 1.98-2.09 (2H, m), 1.78-2.87 (2H, m), 1.50-1.65 (6H, m), 1.38-1.48 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 676 ( $M-1$ )

化合物487 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカル

ボニル) - 4-ヨード-フェニル] - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 487 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.38–8.45 (2H, m), 8.24 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.87–7.97 (3H, m), 7.68 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d,  $J=10.5\text{ Hz}$ ), 2.59 (4H, s), 2.28–2.38 (1H, m), 2.04 (2H, t,  $J=11.7\text{ Hz}$ ), 1.80–1.90 (2H, m), 1.55–1.65 (6H, m), 1.41–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 750 ( $M-1$ )

化合物 488 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ヨード-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル] - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 488 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.34 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.87–7.97 (3H, m), 7.48–7.60 (3H, m), 7.27–7.36 (2H, m), 6.96–7.03 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.60 (2H, s), 2.97 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 2.55 (4H, bs), 2.23–2.33 (1H, m), 2.03 (2H, t,  $J=11.6\text{ Hz}$ ), 1.83 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 1.53–1.65 (6H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 678 ( $M-1$ )

化合物 489 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[4-ヨード-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル] - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 489 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.$

8 Hz), 8.32 (1H, s), 8.18–8.22 (1H, m), 7.87–7.97 (3H, m), 7.75–7.82 (2H, m), 7.55–7.62 (1H, m), 7.45–7.55 (1H, m), 6.95–7.03 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.61 (2H, s), 2.93–3.02 (2H, m), 2.56 (4H, bs), 2.20–2.35 (1H, m), 2.00–2.10 (2H, m), 1.80–1.88 (2H, m), 1.55–1.65 (6H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 678 (M-1)

化合物 490 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(3-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 490 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.43 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.29 (1H, s), 8.19–8.22 (1H, m), 7.87–7.97 (3H, m), 7.57 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.47–7.53 (1H, m), 7.30 (1H, s), 7.18–7.27 (2H, m), 6.83–6.89 (1H, m), 3.61 (2H, s), 2.98 (2H, d,  $J=10.5$  Hz), 2.56 (4H, bs), 2.25–2.35 (1H, m), 2.04 (2H, t,  $J=12.0$  Hz), 1.84 (2H, d,  $J=12.0$  Hz), 1.53–1.66 (6H, m), 1.40–1.50 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 664 (M-1)

化合物 491 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[2-(4-ヒドロキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヨードフェニル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 491 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.44 (1H, dd,  $J=3.7$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 8.27 (1H, s), 8.18 (1H, bs), 7.86–7.96 (3H, m), 7.65–7.72 (2H, m), 7.54

—7. 61 (1H, m), 7. 47—7. 54 (1H, m), 6. 79—6. 86 (2H, m), 3. 59—3. 64 (2H, m), 2. 93—3. 03 (4H, m), 2. 57 (4H, b s), 2. 25—2. 37 (1H, m), 1. 95—2. 10 (2H, m), 1. 80—1. 90 (2H, m), 1. 58 (6H, b s), 1. 45 (2H, b s)

質量分析 (ESI-MS) 664 (M-1)

化合物 492 N- {4-クロロ-2- [N' - (3, 4-ジメチル-ベンジル) -ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 492 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 60 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7. 90 (1H, s), 7. 78 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 59—7. 70 (2H, m), 7. 45—7. 55 (2H, m), 7. 09—7. 13 (2H, m), 7. 01 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 3. 96 (2H, s), 3. 86 (2H, s), 3. 67 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2. 58 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2. 16 (3H, s), 2. 09 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 496, 498, 499 (M-1)

化合物 493 N- [4-クロロ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (2-ヒドロキシ-エタンスルフォニルメチル) -ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 493 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 67 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 31 (1H, s), 8. 11 (1H, s), 8. 04 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 94 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7. 73 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 67 (1H, s), 7. 58—7. 64 (2H, m), 7. 54 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7. 21 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 4. 63 (2H, s), 4. 06 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 3. 20 (2H, t,  $J=5.7$  Hz), 2. 32 (3H, s), 2. 32 (3H,

s)

質量分析 (ESI-MS) 526, 528, 529 (M-1)

化合物 494 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-メチル-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 494 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.52 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.93 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.65-7.74 (3H, m), 7.54 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.21-7.30 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 448, 450 (M-1)

化合物 495 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 495 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.72 (1H, s), 8.67 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.28 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.86-7.92 (2H, m), 7.66 (1H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 7.51-7.60 (2H, m), 7.46-7.51 (1H, m), 7.33-7.39 (1H, m), 7.03-7.10 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 439, 441 (M-1)

化合物 496 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 496 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.70 (1H, d,  $J=4.1$  Hz), 8.65 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.84-7.91 (2H, m), 7.74-7.81 (2H, m), 7.61-7.66 (1H, m), 7.44-7.



5.0 (1H, m), 7.06 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ )  
 質量分析 (ESI-MS) 439, 441 (M-1)

化合物 497 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
 実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 497 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.69 (1H, s), 8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.79-7.89 (2H, m), 7.57-7.66 (2H, m), 7.48-7.54 (1H, m), 7.41-7.46 (1H, m), 7.21-7.27 (1H, m), 7.11-7.17 (1H, m), 2.35 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 435, 437 (M-1)

化合物 498 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド  
 実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 498 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=3.9\text{ Hz}$ ), 8.58 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.24 (1H, s), 8.16 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.77-7.84 (2H, m), 7.52-7.62 (3H, m), 7.37-7.42 (1H, m), 7.11 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 2.25 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 435, 437 (M-1)

化合物 499 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブロモ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 499 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.69 (1H, s), 8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.24 (1H, s), 8.21 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.80-7.89 (2H, m), 7.57-7.63 (2H, m), 7.42-7.47 (2H, m), 7.12 (1H, d,  $J=7.6$

H z), 2.26 (3H, s), 2.21 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 449, 451 (M-1)

化合物 500 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 500 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, s), 8.59 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.24 (1H, s), 8.14 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.97 (1H, s), 7.92 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.78-7.84 (2H, m), 7.58 (1H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.45 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.38-7.43 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 523, 525 (M-1)

化合物 501 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 501 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.52 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.35 (1H, s), 7.99 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.71 (1H, s), 7.51-7.60 (3H, m), 7.35-7.42 (1H, m), 7.09-7.15 (1H, m), 6.95-6.99 (2H, m), 4.10 (2H, q,  $J=7.0$  Hz), 1.45 (3H, t,  $J=7.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 482, 484 (M-1)

化合物 502 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 502 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.53 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.25 (1H, s), 7.92 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.70-7.79 (3H, m), 7.55 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.2$  Hz)

2 Hz), 7.00–7.09 (2H, m), 6.87–6.94 (2H, m), 4.04 (2H, q,  $J=7.0$  Hz), 1.39 (3H, t,  $J=7.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 482, 484 ( $M-1$ )

化合物 503 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシ-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 503 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.31 (1H, s), 7.99 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.71 (2H, s), 7.69 (1H, s), 7.53–7.59 (1H, m), 7.22 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 6.96 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 4.09 (2H, q,  $J=7.0$  Hz), 2.38 (3H, s), 1.44 (3H, t,  $J=7.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 478, 480 ( $M-1$ )

化合物 504 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-エトキシ-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 504 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.48 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 8.33 (1H, s), 7.99 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.69 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.45–7.56 (2H, m), 7.16 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 6.92–6.98 (2H, m), 4.08 (2H, q,  $J=6.9$  Hz), 2.29 (3H, s), 2.27 (3H, s), 1.44 (3H, t,  $J=6.8$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 492, 494 ( $M-1$ )

化合物 505 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 505 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.65–8.76 (2H, m), 8.20–8.28 (2H, m), 7.86–7.92 (1H, m), 7.

6.5–7.72 (1H, m), 7.50–7.61 (3H, m), 7.43–7.50 (1H, m), 7.31–7.38 (1H, m), 7.10–7.20 (1H, m), 7.02–7.10 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 506 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 506 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65–8.75 (2H, m), 8.20–8.28 (2H, m), 7.88 (1H, dd,  $J=1.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.74–7.83 (2H, m), 7.63–7.70 (1H, m), 7.51–7.59 (1H, m), 7.43–7.49 (1H, m), 7.09–7.19 (1H, m), 7.06 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 361 (M-1)

化合物 507 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 507 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65–8.74 (2H, m), 8.23 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.20 (1H, s), 7.87 (1H, ddd,  $J=1.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.63–7.69 (1H, m), 7.57–7.63 (1H, m), 7.49–7.57 (1H, m), 7.42–7.49 (2H, m), 7.07–7.15 (2H, m), 2.26 (3H, s), 2.24 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 371 (M-1)

化合物 508 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド [2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 508 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.67–8.73 (2H,

m), 8.29 (1H, s), 8.23 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.96–8.05 (2H, m), 7.89 (1H, d d d,  $J=1.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.70 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.46–7.59 (3H, m), 7.11–7.18 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 445 (M-1)

化合物 509 シクロヘキサンカルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 509 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.49 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.22–8.29 (1H, m), 7.48–7.68 (3H, m), 7.35–7.44 (2H, m), 7.12–7.18 (1H, m), 2.27–2.36 (1H, m), 1.97–2.04 (2H, m), 1.79–1.87 (2H, m), 1.66–1.73 (1H, m), 1.45–1.52 (1H, m), 1.21–1.38 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 444, 446 (M-1)

化合物 510 イソキサゾール-5-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 510 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.59 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.39 (1H, d,  $J=2.0$  Hz), 8.31 (1H, s), 7.92 (1H, s), 7.63 (1H, d d,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.51–7.59 (2H, m), 7.34–7.41 (1H, m), 7.07–7.13 (1H, m), 7.03 (1H, d,  $J=1.7$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 429, 431 (M-1)

化合物 511 イソキサゾール-5-カルボキシリック アシッド [4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 1 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8. 58 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8. 39 (1H, d,  $J=2.0\text{Hz}$ ), 8. 29 (1H, s), 7. 93 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7. 63–7. 70 (2H, m), 7. 55 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7. 17–7. 31 (2H, m), 7. 03 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 2. 38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 425, 427 ( $M-1$ )

化合物 5 1 2 イソキサゾール-5-カルボキシリック アシッド [4-プロモ-2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 2 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8. 59 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8. 40 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 8. 26 (1H, s), 7. 96 (1H, d,  $J=2.2\text{Hz}$ ), 7. 68 (1H, dd,  $J=2.2\text{Hz}$ ,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7. 63 (1H, s), 7. 51 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7. 18 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7. 05 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 2. 30 (3H, s), 2. 29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 439, 441 ( $M-1$ )

化合物 5 1 3 イソキサゾール-5-カルボキシリック アシッド [4-プロモ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 3 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8. 60 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8. 42 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 8. 35 (1H, s), 8. 10 (1H, s), 8. 04 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7. 97–8. 01 (1H, m), 7. 70 (1H, dd,  $J=2.3\text{Hz}$ ,  $J=8.9\text{Hz}$ ), 7. 58 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7. 06 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 513, 515 ( $M-1$ )

化合物 5 1 4 2, 5-ジメチル-フラン-3-カルボキシリック アシッド  
[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-  
アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 4 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 8.27 (1H, s), 7.46–7.68 (4H, m), 7.35–7.42 (1H, m), 7.04–7.14 (2H, m), 6.39 (1H, s), 2.62 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 378 ( $M-1$ )

化合物 5 1 5 2, 5-ジメチル-フラン-3-カルボキシリック アシッド  
[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-  
アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 5 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.54 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 8.27 (1H, s), 7.76–7.85 (2H, m), 7.61 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.48 (1H, t,  $J=7.8$  Hz), 7.01–7.16 (3H, m), 6.38 (1H, s), 2.62 (3H, s), 2.28 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 378 ( $M-1$ )

化合物 5 1 6 2, 5-ジメチル-フラン-3-カルボキシリック アシッド  
[2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-  
アミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 6 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 8.27 (1H, s), 7.67–7.74 (1H, m), 7.40–7.60 (4H, m), 7.28–7.35 (1H, m), 6.96–7.04 (1H, m), 6.38 (1H, s), 2.64 (3H, s), 2.40 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 374 ( $M-1$ )

化合物 5 1 7 N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 7 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.15 (1H, s), 7.62-7.69 (2H, m), 7.58 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.37-7.44 (1H, m), 7.10-7.17 (1H, m), 6.93 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 6.53 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.60 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 440 (M-1)

化合物 5 1 8 3, 4-ジメトキシ-N- [4-メチル-3- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 8 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.10 (1H, s), 7.63-7.72 (3H, m), 7.54 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.24-7.35 (2H, m), 6.92 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 6.53 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

化合物 5 1 9 3, 4-ジメトキシ-N- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 1 9 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.10 (1H, s), 7.63-7.73 (4H, m), 7.22-7.28 (2H, m), 6.92 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 6.54 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 436 (M-1)

化合物 5 2 1 N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカル



ボニル) - 4 - メチルーチオフェン - 2 - イル] - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 1 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.07 (1H, s), 7.63 - 7.70 (3H, m), 7.47 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.19 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 6.92 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 6.54 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s), 2.31 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 450 ( $M-1$ )

化合物 5 2 2 N - [3 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチルーベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - 4 - メチルーチオフェン - 2 - イル] - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 2 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.23 (1H, s), 8.05 - 8.08 (1H, m), 7.93 - 7.98 (1H, m), 7.62 - 7.68 (2H, m), 7.58 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 6.92 - 7.68 (2H, m), 7.58 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 6.92 - 6.97 (1H, m), 6.55 (1H, s), 3.98 (3H, s), 3.96 (3H, s), 2.61 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 524 ( $M-1$ )

化合物 5 2 3 N - [2 - (3, 4 - ジメチルーベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - 4 - メチルーチオフェン - 3 - イル] - 3 - (1H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503 ( $M-1$ )

化合物 5 2 4 N - [2 - (3 - フルオロ - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - 4 - メチルーチオフェン - 3 - イル] - 3 - (1H - [1, 2, 4] トリアゾール - 3 - イルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

化合物 5 2 5 N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

化合物 5 2 6 3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-N-[4-メチル-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

化合物 5 2 7 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-(3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

化合物 5 2 8 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

化合物 5 2 9 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 2 9 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 522 (M-1)

化合物 5 3 0 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-メトキシー-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 0 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 3 4 (M-1)

化合物 5 3 1 3- [1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-  
[2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-  
チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 1 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 7 2 (M-1)

化合物 5 3 2 N-[2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカル  
ボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ  
エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 3 2 (M-1)

化合物 5 3 3 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イル  
メチル]-N-[4-メチル-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカ  
ルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 1 8 (M-1)

化合物 5 3 4 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニ  
ル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエ  
チル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 2 2 (M-1)

化合物 5 3 5 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニ  
ル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエ  
チル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 3 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 5 2 2 (M-1)

化合物 5 3 6 3-[(2-ジエチルアミノエチルアミノ)-メチル]-N-  
[2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチ

ルーチオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物536を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

化合物537 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[4-メチル-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物537を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

化合物538 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物538を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

化合物539 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物539を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

化合物540 3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-メチル-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物540を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 521 (M-1)

化合物541 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例5に記載の方法に従って、表題の化合物541を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

化合物542 N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-3-イル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

ル) - 4-メチルーチオフェン-3-イル] - 3- (4-ヒドロキシーピペリジン-1-イルメチル) - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 2 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

化合物 5 4 3 3- (4-ヒドロキシーピペリジン-1-イルメチル) - N- [2- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチルーチオフェン-3-イル] - ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 3 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

化合物 5 4 4 ピリジン-2-カルボキシリック アシッド {4-ブromo-2- [N' - (4-メチルーベンジル) - ヒドラジノカルボニル] - フェニル} - アミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 4 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 439 (M-1)

化合物 5 4 5 N- {2- [N' - (4-メチルーベンジル) - ヒドラジノカルボニル] - フェニル} - イソニコチンアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 5 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 359 (M-1)

化合物 5 4 6 N- {4-ブromo-2- [N' - (4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジル) - ヒドラジノカルボニル] - フェニル} - 3- (2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 6 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 614, 616, 617 (M-1)

化合物 5 4 7 N- {4-クロロ-2- [N' - (4-メチルーベンジル) - ヒドラジノカルボニル] - フェニル} - 3- (2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 7 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 483 (M-1)

化合物 5 4 8 N- {4-ブromo-2- [N' - (3, 4-ジメチルーベンジ

ル) -ヒドラジノカルボニル] -フェニル} - 3, 4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 7 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 8 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 508, 510 (M-1)

化合物 5 4 9 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 4 9 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.35 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.93-7.96 (1H, m), 7.85-7.96 (1H, m), 7.85-7.92 (1H, m), 7.71-7.76 (1H, m), 7.58-7.65 (3H, m), 7.40-7.54 (2H, m), 7.15-7.23 (1H, m), 3.83 (2H, s), 3.61-3.67 (4H, m), 2.67-2.74 (4H, m)  
質量分析 (ESI-MS) 511, 513 (M-1)

化合物 5 5 0 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-クロロ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 5 5 0 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.35 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.87-7.95 (4H, m), 7.63 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.62 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.19 (2H, dd,  $J=8.8$  Hz), 3.83 (2H, s), 3.65 (4H, t,  $J=5.9$  Hz), 2.71 (4H, t,  $J=5.9$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 511, 513 (M-1)

#### 実施例 8

化合物 5 5 1 N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -3- (1H- [1, 2, 4]

トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート (化合物 A) (3.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、0℃にてピリジン (1.5 ml)、3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (2.8 ml) をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ-4-メチル-チオフェン-3-カルボキリックアシッドエチルエステルを製造した (3.80 g, 収率70%)。

上記反応で得られた、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ-4-メチル-チオフェン-3-カルボキリックアシッドエチルエステル (700 mg) を、無水塩化メチレン (5.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (580  $\mu$ l)、3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール (化合物 B') (404 mg) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である 4-メチル-2-[3 (1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-チオフェン-3-カルボキシルリッickアシッドエチルエステルを製造した (606 mg、収率72%)。

上記反応で得られた、4-メチル-2-[3 (1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-チオフェン-3-カルボキシルリッickアシッドエチルエステルを、エタノール (5.0 ml) に溶解させ、ヒドラジン-水和物 (650  $\mu$ l) を加え、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮し、ヒドラジン化合物 N-(3-ヒドラジノカルボニル-4-メチル-チオフェン-2-イル)-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミドを製造した (103 mg、粗収率20%)。

N- (3-ヒドラジノカルボニル-4-メチル-チオフエン-2-イル)-3- (1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド (20 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物C) (13.0  $\mu$ l) を添加し、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物551を製造した (17.4 mg、収率69%)。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.25 (6H, s), 2.37 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.79 (1H, s), 7.15-8.00 (7H, m), 8.28 (1H, s), 8.56 (1H, s), 11.20-11.70 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

化合物552 N- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-3- (1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物552を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.34 (3H, s), 2.37 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.80 (1H, s), 7.20-8.00 (8H, m), 8.30 (1H, m), 8.57 (1H, s), 11.30-11.70 (2H, m), 14.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 489 (M-1)

化合物553 N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3- (1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物553を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.36 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.81 (1H, s), 7.25-8.00 (8H, m), 8.40 (1H, m), 8.57 (1H, s), 11.30-11.70 (2H, m), 14.05 (1H, s)



質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

化合物 554 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 554 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.35 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.81 (1H, s), 7.20-7.96 (8H, m), 8.36 (1H, s), 8.56 (1H, s), 11.40-11.75 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

化合物 555 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 555 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.34 (3H, s), 4.38 (2H, s), 6.82 (1H, s), 7.40-8.58 (9H, m), 11.40-11.75 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

化合物 556 N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 556 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.37 (3H, s), 3.80 (3H, s), 4.40 (2H, s), 6.80 (1H, s), 7.01 (2H, m), 7.40-7.74 (6H, m), 8.35 (1H, s), 8.57 (1H, s), 11.20-11.75 (2H, m), 14.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

化合物 5 5 7 N- [3- (3, 4-ジメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 5 5 7 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 77 (2H, m), 2. 31 (6H, m), 2. 50 (5H, m), 3. 63 (2H, m), 3. 82 (2H, s), 6. 70 (1H, s), 7. 19 (1H, d,  $J=7. 8\text{ Hz}$ ), 7. 45-7. 67 (4H, m), 7. 80-7. 95 (2H, m), 8. 22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 494 (M-1)

化合物 5 5 8 3- (3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル) -N- [4-メチルー3- (4-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 5 5 8 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 77 (2H, m), 2. 38 (3H, s), 2. 50 (5H, m), 3. 60 (2H, t,  $J=6. 4\text{ Hz}$ ), 3. 82 (2H, s), 6. 71 (1H, d,  $J=0. 96\text{ Hz}$ ), 7. 26 (2H, d,  $J=7. 6\text{ Hz}$ ) 7. 50 (1H, m), 7. 60 (1H, m), 7. 73 (2H, m), 7. 84 (1H, m), 7. 92 (1H, s), 8. 26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

化合物 5 5 9 N- [3- (4-フルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 5 5 9 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 77 (2H, m), 2. 50 (5H, m), 3. 62 (2H, m), 3. 82 (2H, s), 6. 71 (1H, s), 7. 12 (2H, m) 7. 50 (1H, m), 7. 60 (1H, m), 7. 87 (4H, m), 8. 28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

化合物 560 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 560 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.77 (2H, m), 2.51 (5H, m), 3.60 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 3.82 (2H, s), 6.72 (1H, s), 7.18 (1H, m), 7.42-7.65 (5H, m), 7.84 (1H, s), 7.93 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 484 (M-1)

化合物 561 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 561 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.77 (2H, m), 2.50 (5H, m), 3.60 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.82 (2H, s), 6.72 (1H, s), 7.50 (1H, m), 7.61 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.68 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.84 (1H, m), 7.93 (1H, s), 8.05 (1H, m), 8.33 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

化合物 562 3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 562 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.77 (2H, m), 2.50 (5H, m), 3.60 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.70 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 6.99 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, m), 7.60 (1H,

m), 7.80 (3H, m), 7.92 (1H, s), 8.23 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

化合物 563 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 563 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.26 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.50 (2H, m), 2.57 (2H, m), 2.67 (5H, m), 2.79 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.64 (1H, s), 7.19 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.46-7.65 (4H, m), 7.86-7.97 (2H, m), 8.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 532 (M-1)

化合物 564 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 564 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.3$  Hz), 2.26 (3H, s), 2.38 (3H, s), 2.50 (2H, s), 2.57 (2H, m), 2.67 (5H, m), 2.78 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.63 (1H, s), 7.25 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.51 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.72 (2H, m), 7.91 (2H, m), 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

化合物 565 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 565 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.05 (6H, m), 2.56 (3H, s), 2.49 (2H, m), 2.57 (2H, m), 2.66 (5H, m), 2.77 (2H, m), 3.64 (2H, s), 6.62 (1H, s), 7.16 (2H, dd,  $J=8.7\text{Hz}$ ,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.50 (2H, m), 7.91 (4H, m), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 ( $M-1$ )

化合物 566 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 566 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.07 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 2.26 (3H, m), 2.50 (2H, s), 2.58 (2H, m), 2.72 (5H, m), 2.83 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.62 (1H, s), 7.15 (1H, ddd,  $J=8.3\text{Hz}$ ,  $J=8.3\text{Hz}$ ,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7.40-7.80 (5H, m), 7.87-7.90 (2H, m), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 ( $M-1$ )

化合物 567 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 567 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.06 (6H, t,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 2.26 (3H, m), 2.49 (2H, s), 2.57 (2H, m), 2.68 (5H, m), 2.80 (2H, m), 3.64 (2H, s), 6.60 (1H, s), 7.50 (1H, m), 7.57 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.65 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.94 (3H, m), 8.28 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 606 ( $M-1$ )

化合物 568 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 568 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.25 (3H, s), 2.49 (2H, s), 2.57 (2H, m), 2.66 (5H, m), 2.77 (2H, m), 3.64 (2H, m), 3.83 (3H, s), 6.63 (1H, s), 6.97 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.42-7.59 (2H, m), 7.76 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1)

化合物 569 3- [1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 569 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  1.49 (2H, m), 1.64 (6H, m), 1.87 (2H, m), 2.03 (2H, m), 2.27 (1H, m), 2.29 (6H, m), 2.49 (3H, s), 2.71 (4H, m), 2.96 (2H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 3.59 (2H, s), 6.66 (1H, s), 7.18 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.45-7.73 (4H, m), 7.88 (2H, s), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 570 (M-1)

化合物 570 3- [1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 570 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  1.49 (2H, m), 1.65 (6H, m), 1.88 (2H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 2.04 (2H, t,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.34 (1H, s), 2.37 (3H, s), 2.49

(3H, s), 2.74 (4H, bs), 2.97 (2H, d,  $J=11.2$  Hz), 3.58 (2H, s), 6.67 (1H, s), 7.24 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.45–7.60 (2H, m), 7.70 (2H, m), 7.85–7.95 (2H, m), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 556 (M-1)

化合物 571 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 571 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.48 (2H, m), 1.63 (6H, m) 1.86 (2H, d,  $J=11.4$  Hz), 2.03 (2H, t,  $J=11.2$  Hz), 2.36–2.54 (4H, m), 2.66 (4H, m), 2.96 (2H, d,  $J=11.2$  Hz), 3.58 (2H, s), 6.66 (1H, s), 7.17 (2H, dd,  $J=8.5$  Hz,  $J=8.5$  Hz), 7.45–7.60 (2H, m), 7.85–7.94 (4H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 560 (M-1)

化合物 572 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 572 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.49 (2H, m), 1.64 (6H, m) 1.87 (2H, d,  $J=11.7$  Hz), 2.03 (2H, t,  $J=11.2$  Hz), 2.49 (4H, s), 2.72 (4H, m), 2.96 (2H, d,  $J=11.5$  Hz), 3.58 (2H, s), 6.65 (1H, s), 7.15 (1H, m), 7.40–7.75 (5H, m), 7.85–7.95 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 560 (M-1)

化合物 573 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-

[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 573 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.49 (2H, m), 1.63 (6H, m), 1.87 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 2.04 (2H, t,  $J=11.1\text{ Hz}$ ), 2.40-2.54 (4H, m), 2.68 (4H, m), 2.97 (2H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 3.59 (2H, s), 6.65 (1H, s), 7.45-7.60 (2H, m), 7.67 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.85-8.05 (3H, m), 8.31 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 644 ( $M-1$ )

化合物 574 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 574 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.49 (2H, m), 1.61 (6H, m), 1.85 (2H, d,  $J=11.7\text{ Hz}$ ), 2.02 (2H, t,  $J=11.6\text{ Hz}$ ), 2.30-2.52 (4H, m), 2.65 (4H, b s), 2.95 (2H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 3.58 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.66 (1H, s), 6.98 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.44-7.61 (2H, m), 7.76 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 572 ( $M-1$ )

化合物 575 N-[3-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 575 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.29 (6H, s), 2.48 (3H, s), 2.52-2.70 (10H, m), 3.62 (2H, s), 3.66 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 6.68 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ )



z), 7.17 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.50 (2H, m), 7.59 (2H, m), 7.80–7.95 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 532 ( $M-1$ )

化合物 576 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 576 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.38 (3H, s), 2.49 (3H, s), 2.54–2.74 (10H, m), 3.60–3.70 (4H, m), 6.71 (1H, d,  $J=1.2\text{ Hz}$ ), 7.25 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ ,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.71 (2H, bs), 7.85–7.95 (2H, m), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 ( $M-1$ )

化合物 577 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 577 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.49 (3H, m), 2.52–2.76 (10H, m), 3.63 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 6.69 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.17 (2H, dd,  $J=8.6\text{ Hz}$ ,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.82–7.94 (4H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 ( $M-1$ )

化合物 578 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 578 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.49 (3H, s), 2.57 (4H, m), 2.64 (2H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ ), 2.71 (4H, m), 3.63 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=5.9\text{Hz}$ ), 6.68 (1H, d,  $J=1.0\text{Hz}$ ), 7.16 (1H, dd,  $J=8.1\text{Hz}$ ,  $J=8.1\text{Hz}$ ), 7.40–7.70 (5H, m), 7.82–7.95 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 522 ( $M-1$ )

化合物 579 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド  
実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 579 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.49 (3H, s), 2.52–2.68 (10H, m), 3.63 (2H, s), 3.66 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 6.70 (1H, d,  $J=1.0\text{Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.3\text{Hz}$ ,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.67 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.87 (1H, m), 7.93 (1H, s), 8.00 (1H, bs), 8.32 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 606 ( $M-1$ )

化合物 580 3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 580 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.49 (3H, s), 2.50–2.75 (10H, m), 3.63 (2H, s), 3.67 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 3.83 (3H, s), 6.69 (1H, d,  $J=1.0\text{Hz}$ ), 6.98 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6\text{Hz}$ ,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.76 (2H, m), 7.82–7.94 (2H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 534 ( $M-1$ )

化合物 581 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 581 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.20 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.31 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.51 (3H, s), 2.91 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 3.02 (6H, m), 3.97 (2H, s), 6.71 (1H, d,  $J=1.0$  Hz), 7.20 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.50-7.70 (4H, m), 7.91 (1H, m), 7.99 (1H, m), 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)

化合物 582 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[4-メチル-3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 582 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.22 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.39 (3H, s), 2.51 (3H, s), 2.93 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 3.06 (6H, m), 3.39 (2H, s), 6.72 (1H, d,  $J=1.0$  Hz), 7.27 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.52-7.77 (4H, m), 7.91 (1H, m), 8.01 (1H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

化合物 583 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 583 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.19 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.52 (3H, s), 2.89 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.98 (6H, m), 3.96 (2H, s), 6.72 (1H, d,  $J=1.0$  Hz)

z), 7.19 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.56 (1H, m), 7.64 (1H, d,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 7.90 (3H, m), 7.99 (1H, s), 8.30 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 509 (M-1)

化合物 584 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 584 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.20 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.52 (3H, s), 2.90 (2H, m), 3.00 (6H, m), 3.96 (2H, s), 6.71 (1H, d,  $J=1.2\text{ Hz}$ ), 7.18 (1H, dd,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.46 (1H, m), 7.52-7.75 (4H, m), 7.91 (1H, m), 7.99 (1H, s), 8.31 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

化合物 585 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 585 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.16 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.51 (3H, s), 2.91 (8H, m), 3.95 (2H, s), 6.70 (1H, d,  $J=1.2\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, m), 7.64 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.69 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.91 (1H, m), 7.98 (2H, m), 8.34 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 592 (M-1)

化合物 586 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 586 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.16 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 2.51 (3H, s), 2.90 (8H, m), 3.85 (3H, s), 3.94 (2H, s), 6.70 (1H, d,  $J=1.0\text{Hz}$ ), 6.99 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.56 (1H, m), 7.64 (1H, m), 7.79 (2H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.91 (1H, m), 7.98 (1H, s), 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520 ( $M-1$ )

化合物 587 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフエン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 587 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.09 (6H, m), 2.31 (6H, m), 2.51 (7H, m), 3.60-3.95 (4H, m), 6.70 (1H, d,  $J=1.0\text{Hz}$ ), 7.19 (1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.52 (2H, m), 7.65 (2H, d,  $J=6.6\text{Hz}$ ), 7.87 (1H, m), 7.99 (1H, s), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 535 ( $M-1$ )

化合物 588 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 588 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.09 (6H, m), 2.38 (3H, s), 2.51 (7H, m), 3.68-3.94 (4H, m), 6.70 (1H, d,  $J=1.2\text{Hz}$ ), 7.25 (2H, m), 7.51 (1H, m), 7.65 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.73 (2H, m), 7.87 (1H, m), 7.99 (1H, s), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 521 ( $M-1$ )

化合物 589 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4

ーメチルーチオフェン-2-イル]ーベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 589 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.09 (6H, m), 2.49 (7H, m), 3.65–3.95 (4H, m), 6.71 (1H, m), 7.18 (2H, dd,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ ,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.65 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.88 (3H, m), 7.99 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 526 (M-1)

化合物 590 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル]ーベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 590 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.09 (6H, m), 2.49 (7H, m), 3.87 (4H, m), 6.71 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.17 (2H, m), 7.40–7.75 (4H, m), 7.87 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 525 (M-1)

化合物 591 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル]ーベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 591 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.08 (6H, m), 2.50 (7H, m), 3.65–3.95 (4H, m), 6.71 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.66 (2H, m), 7.86 (1H, m), 8.02 (2H, m), 8.33 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 609 (M-1)

化合物 592 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-

ーメチルーチオフェン-2-イル]ーベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 592 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.09 (6H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.49 (7H, m), 3.85 (7H, m), 6.70 (1H, d,  $J=1.0$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.51 (1H, m), 7.65 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.84 (3H, m), 7.99 (1H, s), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 537 (M-1)

化合物 593 N-[3-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルーチオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 593 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.59 (2H, m), 1.85 (2H, m), 2.29 (8H, bs), 2.48 (3H, s), 2.84 (2H, m), 3.66 (3H, m), 6.68 (1H, d,  $J=1.0$  Hz), 7.17 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.52 (1H, m), 7.61 (2H, d,  $J=5.6$  Hz), 7.89 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

化合物 594 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[4-メチルー3-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 594 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.59 (2H, m), 1.86 (2H, m), 2.35 (5H, m), 2.49 (3H, s), 2.87 (2H, m), 3.67 (3H, m), 6.70 (1H, d,  $J=1.2$  Hz), 7.25 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.53 (1H, dd,  $J=7.3$  Hz,  $J=7.3$  Hz), 7.63 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.71 (2H, m), 7.91 (2H, m), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 489 (M-1)

化合物 595 N-〔3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル〕-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 595 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.62 (2H, m), 1.87 (2H, m), 2.36 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.89 (2H, m), 3.66 (1H, m), 3.74 (2H, s), 6.72 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.18 (2H, dd,  $J=8.6\text{ Hz}$ ,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.54 (1H, m), 7.64 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.91 (4H, m), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 ( $M-1$ )

化合物 596 N-〔3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル〕-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 596 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 1.60 (2H, m), 1.87 (2H, m), 2.35 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.88 (2H, m), 3.66 (1H, m), 3.72 (2H, s), 6.69 (1H, d,  $J=1.1\text{ Hz}$ ), 7.16 (1H, dd,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.44 (1H, m), 7.53 (2H, m), 7.63 (2H, m), 7.91 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 ( $M-1$ )

化合物 597 N-〔3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル〕-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 597 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.61 (2H, m), 1.86 (2H, m), 2.37 (2H, m), 2.50 (3H, s), 2.90 (2H, m), 3.67 (1H, m), 3.74 (2H, s), 6.72 (1H, d,



$J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, dd,  $J=7.5\text{ Hz}$ ,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 7.66 (2H, m), 7.92 (3H, m), 8.33 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

化合物 598 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 598 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.61 (2H, m), 1.87 (2H, m), 2.37 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.89 (2H, m), 3.66 (1H, m), 3.73 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.69 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 6.97 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, m), 7.62 (1H, m), 7.76 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 505 (M-1)

化合物 599 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 599 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.29 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.19 (2H, m), 2.30 (6H, s), 2.49 (3H, s), 2.99 (2H, d,  $J=10.8\text{ Hz}$ ), 3.38 (2H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 3.73 (2H, s), 6.70 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.19 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.54 (2H, m), 7.62 (2H, m), 7.91 (2H, m), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 517 (M-1)

化合物 600 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[4-メチル-3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 600 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.30 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d,  $J=13.2\text{ Hz}$ ), 2.22 (2H, t,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.37 (3H, s), 2.48 (3H, s), 3.00 (2H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 3.38 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.74 (2H, s), 6.68 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.24 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ ,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.69 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 503 (M-1)

化合物 601 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチルペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 601 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.30 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d,  $J=12.2\text{ Hz}$ ), 2.22 (2H, t,  $J=11.4\text{ Hz}$ ), 2.48 (3H, s), 3.01 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 3.38 (2H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.73 (2H, s), 6.68 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.16 (2H, dd,  $J=8.6\text{ Hz}$ ,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.88 (4H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

化合物 602 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチルペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 602 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.31 (2H, m), 1.51 (1H, m), 1.76 (2H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.23 (2H,

d,  $J=10.8\text{ Hz}$ ), 2.45 (3H, s), 3.02 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 3.39 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.75 (2H, s), 6.69 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.17 (1H, m), 7.44 (1H, m), 7.53 (2H, m), 7.63 (2H, m), 7.90 (2H, m), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507 ( $M-1$ )

化合物 603 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 603 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.31 (2H, m), 1.51 (1H, m), 1.76 (2H, d,  $J=11.7\text{ Hz}$ ), 2.21 (2H, t,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.49 (3H, s), 3.01 (2H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 3.38 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.74 (2H, s), 6.70 (1H, s), 7.54 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.65 (2H, m), 7.94 (3H, m), 8.31 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 591 ( $M-1$ )

化合物 604 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフエン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 604 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.29 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.75 (2H, d,  $J=12.2\text{ Hz}$ ), 2.20 (2H, t,  $J=11.1\text{ Hz}$ ), 2.47 (3H, s), 3.00 (2H, d,  $J=10.8\text{ Hz}$ ), 3.38 (2H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.72 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.67 (1H, s), 6.96 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.61 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.75 (2H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 7.89 (2H, m), 8.23 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 519 (M-1)

化合物 605 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド  
実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 605 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.77 (2H, m), 1.89 (4H, m), 2.30 (6H, s), 2.51 (2H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.74 (2H, m), 2.85 (2H, m), 3.60 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 3.82 (2H, s), 7.19 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.51 (2H, m), 7.61 (2H, m), 7.87 (2H, m), 8.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1)

化合物 606 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド  
実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 606 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.77 (2H, m), 1.89 (4H, m), 2.51 (2H, t,  $J=7.3$  Hz), 2.75 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.60 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 3.82 (2H, s), 7.18 (2H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.87 (2H, m), 8.06 (2H, m), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 524 (M-1)

化合物 607 N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド  
実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 607 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.77 (2H, m), 1.9

0 (4H, m), 2.51 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 2.77 (2H, m), 2.86 (2H, bs), 3.63 (2H, m), 3.82 (2H, s), 7.17 (1H, dd,  $J=8.0\text{ Hz}$ ,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.55 (5H, m), 7.84 (1H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, s), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 524 (M-1)

化合物 608 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 608 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.77 (2H, m), 1.90 (4H, m), 2.51 (2H, m), 2.76 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.60 (2H, m), 3.83 (2H, s), 7.52 (1H, m), 7.62 (1H, m), 7.68 (1H, m), 7.75-8.08 (4H, m), 8.32 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 608 (M-1)

化合物 609 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 609 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.08 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 1.85 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.29 (6H, s), 2.75 (12H, m), 3.62 (2H, s), 7.17 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.44 (2H, dd,  $J=15.0\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.55 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.63 (2H, s), 7.95 (2H, m), 8.06 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 572 (M-1)

化合物 610 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 610 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.08 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.85 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.37 (3H, s), 2.74 (12H, m), 3.61 (2H, s), 7.20 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.44 (1H, dd,  $J=15.9$  Hz,  $J=8.1$  Hz), 7.54 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.66 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.95 (2H, m), 8.12 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 558 ( $M-1$ )

化合物 611 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 611 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.10 (6H, t,  $J=7.3$  Hz), 1.83 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.75 (12H, m), 3.61 (2H, s), 7.09 (2H, dd,  $J=8.6$  Hz,  $J=8.6$  Hz), 7.44 (1H, dd,  $J=15.1$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.54 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.76 (2H, m), 7.93 (2H, m), 8.16 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562 ( $M-1$ )

化合物 612 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 612 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.11 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 1.81 (4H, m), 2.23 (3H, s), 2.77 (12H, m), 3.61 (2H, s), 7.08 (1H, m), 7.31–7.59 (4H, m), 7.91 (2H, m), 8.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562 ( $M-1$ )

化合物 613 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 613 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.10 (6H, m), 1.91 (4H, m), 2.25 (3H, s), 2.55–2.80 (12H, m), 3.63 (2H, s), 7.46 (1H, m), 7.57 (2H, d,  $8.3\text{Hz}$ ), 7.94 (3H, m), 8.04 (1H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 646 ( $M-1$ )

化合物 614 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 614 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 1.83 (4H, m), 2.23 (3H, s), 2.68 (12H, m), 3.60 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.89 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.45 (1H, dd,  $J=15.4\text{Hz}$ ,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.56 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.70 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.82–8.02 (2H, m), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 574 ( $M-1$ )

化合物 615 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-

[3-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド  
実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物615を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.46 (2H, bs), 1.68-2.06 (15H, m), 2.27 (6H, s), 2.60-3.02 (10H, m), 3.54 (2H, s), 7.14 (1H, m), 7.46 (3H, m), 7.60 (1H, s), 7.94 (2H, m), 8.11 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 610 (M-1)

化合物616 3-[1,4']ピピペリジンイル-1'-イルメチルーN-[3-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド  
実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物616を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.47 (2H, bs), 1.68-2.08 (14H, m), 2.37 (3H, s), 2.65-3.00 (11H, m), 3.54 (2H, s), 7.20 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, m), 7.66 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.90 (2H, m), 8.16 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 596 (M-1)

化合物617 3-[1,4']ピピペリジンイル-1'-イルメチルーN-[3-(4-フルオローベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド  
実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物617を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.48 (2H, bs), 1.65-2.10 (14H, m), 2.74 (7H, m), 2.87 (2H, m), 2.94 (2H, m), 3.55 (2H, s), 7.10 (2H, dd,  $J=8.6\text{ Hz}$ ,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.46 (2H, m), 7.77 (2H, m), 7.92 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 8.18 (1H, s)



質量分析 (ESI-MS) 600 (M-1)

化合物 618 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 618 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz) :  $\delta$  1.48 (2H, bs), 1.70-2.08 (14H, m), 2.86 (11H, m), 3.55 (2H, s), 7.10 (1H, ddd,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.50 (5H, m), 7.91 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 8.20 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 600 (M-1)

化合物 619 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 619 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz) :  $\delta$  1.47 (2H, bs), 1.86 (14H, m), 2.84 (11H, m), 3.53 (2H, s), 7.48 (3H, m), 7.91 (3H, m), 8.01 (1H, s), 8.31 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 684 (M-1)

化合物 620 3-[1, 4'] ビピペリジンイル-1'-イルメチル-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 620 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz) :  $\delta$  1.47 (2H, bs), 1.85 (14H, m), 2.82 (11H, m), 3.53 (2H, bs), 3.82 (3H, m), 6.90 (2H, m), 7.43 (2H, m), 7.69 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.91 (2H, m), 8.15 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 612 (M-1)

化合物 6 2 1 N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 2 1 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.87 (4H, m), 2.29 (6H, s), 2.55 (10H, m), 2.72 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.60 (4H, m), 7.16 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.43 (2H, m), 7.54 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 572 (M-1)

化合物 6 2 2 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 2 2 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.85 (4H, m), 2.37 (3H, s), 2.54 (10H, m), 2.71 (2H, m), 2.85 (2H, m), 3.60 (4H, m), 7.20 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.43 (1H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.54 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.66 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 558 (M-1)

化合物 6 2 3 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 2 3 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 8 7 (4 H, m), 2. 5 4 (10 H, m), 2. 7 3 (2 H, m), 2. 8 6 (2 H, m), 3. 6 0 (4 H, m), 7. 1 1 (2 H, dd,  $J=8.7$  Hz,  $J=8.7$  Hz), 7. 4 4 (1 H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7. 5 4 (1 H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 7 9 (2 H, m) 7. 9 2 (1 H, m), 8. 0 0 (1 H, s), 8. 1 2 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 5 6 2 ( $M-1$ )

化合物 6 2 4 N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -3- [4- (2-ヒドロキシ-エチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 2 4 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 8 7 (4 H, m), 2. 5 4 (10 H, m), 2. 7 2 (2 H, m), 2. 8 4 (2 H, m), 3. 6 0 (4 H, m), 7. 1 1 (1 H, ddd,  $J=8.3$  Hz,  $J=8.3$  Hz,  $J=2.4$  Hz), 7. 4 5 (5 H, m), 7. 9 2 (1 H, d,  $J=7.6$  Hz), 8. 0 0 (1 H, s), 8. 1 4 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 5 6 2 ( $M-1$ )

化合物 6 2 5 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -3- [4- (2-ヒドロキシ-エチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 2 5 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 8 3 (4 H, m), 2. 5 3 (10 H, m) 2. 6 9 (2 H, m), 2. 8 2 (2 H, m), 3. 6 0 (4 H, m), 7. 4 4 (1 H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7. 5 4 (2 H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 9 2 (2 H, m), 7. 9 8 (1 H, s), 8. 0 1 (1 H, s), 8. 2 2 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 646 (M-1)

化合物 626 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 626 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.85 (4H, m), 2.53 (10H, m), 2.70 (2H, m), 2.84 (2H, m), 3.59 (4H, m), 3.83 (3H, s), 6.90 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.42 (1H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.72 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.99 (1H, s), 8.07 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 574 (M-1)

化合物 627 3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 627 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.14 (6H, m), 1.84 (4H, m), 2.25 (6H, m), 2.50 (2H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ ), 2.62 (2H, m), 2.70 (2H, m), 2.83 (2H, m), 3.81-4.06 (4H, m), 7.08 (1H, m), 7.46 (3H, m), 7.60 (1H, s), 8.02 (2H, m), 8.20 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 575 (M-1)

化合物 628 3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 628 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.13 (6H, m), 1.87 (4H, m), 2.37 (3H, m), 2.50 (2H, d,  $J=5.6\text{Hz}$ ), 2.62 (2H, m), 2.71 (2H, m), 2.84 (2H, m), 3.93 (4H, m), 7.16 (2H, m), 7.44 (2H, m), 7.70 (2H, m), 8.00 (2H, m), 8.22 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 561 ( $M-1$ )

化合物 629 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 629 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.12 (6H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 1.88 (4H, m), 2.50 (2H, m), 2.63 (2H, m), 2.73 (2H, m), 2.84 (2H, m), 3.94 (4H, m), 7.06 (2H, dd,  $J=8.6\text{Hz}$ ,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.44 (2H, m), 7.85 (2H, m), 8.05 (2H, m), 8.25 (1H, d,  $J=6.8\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 565 ( $M-1$ )

化合物 630 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 630 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.14 (6H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 1.84 (4H, m), 2.51 (2H, m), 2.66 (4H, m), 2.83 (2H, m), 3.95 (4H, m), 7.00 (1H, m), 7.23 (1H, m), 7.42 (3H, m), 7.72 (1H, m), 8.03 (1H, m), 8.18 (1H, s), 8.27 (1H, d,  $J=10.3\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 565 (M-1)

化合物 631 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 631 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.12 (6H, m), 1.72 (4H, m), 2.52 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.68 (6H, m), 3.97 (4H, m), 7.32 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.43 (2H, m), 7.87 (1H, m), 8.01 (2H, m), 8.30 (1H, s), 8.33 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 649 (M-1)

化合物 632 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 632 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.13 (6H, m), 1.86 (4H, m), 2.49 (2H, m), 2.62 (2H, m), 2.70 (2H, m), 2.81 (2H, m), 3.75-4.05 (7H, m), 6.82 (2H, m), 7.42 (2H, m), 7.74 (2H, m), 8.01 (1H, m), 8.06 (1H, s), 8.23 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

化合物 633 N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -3- (4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル) -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 633 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.64 (2H, m), 1.85 (6H, m), 2.25 (8H, m), 2.75 (6H, m), 3.63 (2

H, s), 3.70 (1H, m), 7.15 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.43 (2H, m), 7.56 (1H, m), 7.61 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.98 (1H, s), 8.06 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 543 ( $M-1$ )

化合物 634 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 634 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.64 (2H, m), 1.86 (6H, m), 2.26 (2H, t,  $J=9.5$  Hz), 2.37 (3H, s), 2.71 (2H, m), 2.81 (4H, m), 3.64 (2H, s), 3.72 (1H, m), 7.19 (2H, d,  $J=7.9$  Hz), 7.43 (1H, dd,  $J=7.8$  Hz), 7.57 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.66 (2H, d,  $J=7.9$  Hz), 7.94 (2H, m), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 529 ( $M-1$ )

化合物 635 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 635 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.64 (2H, m), 1.90 (6H, m), 2.23 (2H, m), 2.80 (6H, m), 3.62 (2H, s), 3.73 (1H, m), 7.11 (2H, dd,  $J=8.6$  Hz,  $J=8.6$  Hz), 7.45 (1H, m), 7.58 (1H, m), 7.79 (2H, dd,  $J=8.6$  Hz,  $J=8.6$  Hz), 7.94 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.99 (1H, s), 8.12 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 ( $M-1$ )

化合物 636 N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-

3- (4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル) -ベンズアミド  
 実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物636を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.69 (2H, m), 1.90 (6H, m), 2.42 (2H, bs), 2.78 (6H, m), 3.75 (3H, m), 7.11 (1H, m), 7.30-7.80 (5H, m), 7.98 (2H, m), 8.14 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 (M-1)

化合物637 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -3- (4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル) -ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物637を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.63 (2H, m), 1.85 (6H, m), 2.19 (2H, m), 2.74 (6H, m), 3.58 (2H, s), 3.71 (1H, m), 7.44 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.54 (2H, m), 7.94 (4H, m), 8.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 617 (M-1)

化合物638 3- (4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル) -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物638を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.62 (2H, m), 1.87 (6H, m), 2.19 (2H, m), 2.77 (6H, m), 3.59 (2H, s), 3.70 (1H, m), 3.83 (3H, s), 6.90 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.43 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.72 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.98 (1H, s), 8.06 (1H, s)



質量分析 (ESI-MS) 545 (M-1)

化合物 639 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 639 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.37 (2H, m), 1.49 (1H, m), 1.71 (2H, m), 1.86 (4H, m), 2.04 (2H, m), 2.29 (6H, s), 2.73 (2H, m), 2.86 (2H, m), 2.93 (2H, m), 3.49 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, s), 7.16 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, m), 7.58 (1H, m), 7.63 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.99 (1H, s), 8.05 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 557 (M-1)

化合物 640 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 640 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.40 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.71 (2H, m), 1.89 (4H, m), 2.06 (2H, m), 2.38 (3H, m), 2.73 (2H, m), 2.86 (2H, m), 2.95 (2H, m), 3.49 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.63 (2H, s), 7.21 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.45 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.68 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.97 (2H, m), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 543 (M-1)

化合物 641 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5,6,7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-

3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド  
実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 641 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.34 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.69 (2H, m), 1.84 (4H, m), 2.01 (2H, m), 2.71 (2H, m), 2.87 (4H, m), 3.49 (2H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.58 (2H, s), 7.10 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.43 (1H, m), 7.55 (1H, m), 7.78 (2H, m), 7.91 (1H, m), 7.98 (1H, bs), 8.13 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

化合物 642 N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド  
実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 642 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.35 (2H, m), 1.51 (1H, m), 1.70 (2H, m), 1.84 (4H, m), 2.01 (2H, m), 2.70 (2H, m), 2.83 (2H, m), 2.90 (2H, m), 3.49 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.58 (2H, s), 7.10 (1H, ddd,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.45 (5H, m), 7.90 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.98 (1H, s), 8.14 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

化合物 643 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 643 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.39 (2H, m), 1.52 (1H, m), 1.72 (2H, m), 1.88 (4H, m), 2.05 (2H, m), 2.66-2.98 (6H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.1$

H z), 3. 61 (2H, s), 7. 46 (1H, m), 7. 57 (1H, m), 7. 86 (1H, m), 7. 96 (3H, m), 8. 04 (1H, s), 8. 21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 631 (M-1)

化合物 644 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド  
実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 644 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 34 (2H, m), 1. 49 (1H, m), 1. 69 (2H, m), 1. 84 (4H, m), 2. 00 (2H, m), 2. 69 (2H, m), 2. 81 (2H, m), 2. 88 (2H, m), 3. 48 (2H, d,  $J=6.4$  Hz), 3. 57 (2H, s), 3. 83 (3H, s), 6. 90 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7. 43 (1H, m), 7. 55 (1H, m), 7. 70 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7. 91 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 97 (1H, m), 8. 07 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 645 N-{3-[N'-(3, 4-ジメチル-ベンジル)-ヒドラジノカルボニル]-4-メチル-チオフェン-2-イル}-3-(3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 645 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 87 (2H, m), 2. 26 (9H, m), 2. 56 (2H, m), 3. 73 (2H, m), 3. 82 (2H, s), 4. 06 (2H, s), 6. 46 (1H, s), 7. 13 (1H, bs), 7. 18 (1H, bs), 7. 50 (1H, m), 7. 57 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 93 (2H, m), 13. 00 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 496 (M-1)

化合物 646 3-[(3, 4-ジメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ [4, 5] チエノ

[2, 3-d] ピリミジン-4-オン

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 646 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.88 (4H, m), 2.31 (3H, s), 2.33 (3H, s), 2.80 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.33 (2H, s), 7.10-7.88 (7H, m), 8.03 (1H, s), 8.76 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 525 (M-1)

化合物 647 3-[(4-メチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 647 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.88 (4H, m), 2.35 (3H, s), 2.80 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.34 (2H, s), 7.17 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.26 (1H, m), 7.37 (1H, m), 7.56 (2H, m), 7.76 (1H, s), 8.00 (2H, m), 8.81 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 511 (M-1)

化合物 648 3-[(4-フルオロ-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 648 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.89 (4H, m), 2.81 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.36 (2H, s), 7.08 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.31 (1H, m), 7.40 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.56 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.69 (2H, m), 7.76 (1H, m), 8.04 (1H, s), 8.92 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 515 (M-1)

化合物 6 4 9 3-[(3-フルオロ-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 4 9 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.89 (4H, m), 2.81 (2H, m), 3.05 (2H, m), 4.36 (2H, s), 7.15 (1H, m), 7.36 (5H, m), 7.55 (1H, m), 7.75 (1H, m), 8.03 (1H, s), 9.01 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 515 (M-1)

化合物 6 5 0 3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 5 0 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.89 (4H, m), 2.68 (2H, m), 2.81 (2H, m), 4.37 (2H, s), 7.30-8.02 (7H, m), 8.06 (1H, m), 9.17 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 599 (M-1)

化合物 6 5 1 3-[(4-メトキシ-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(1H-[1, 2, 4] トリアゾール-3-イルスルファニルメチル)-フェニル]-5, 6, 7, 8-テトラヒドロ-3H-ベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジン-4-オン

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 5 1 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.88 (4H, m), 2.80 (2H, m), 3.05 (2H, m), 3.81 (3H, s), 4.33 (2H, s), 6.87 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.28 (1H, m), 7.55 (1H, m), 7.61 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.76 (1H, m), 8.00 (1H, s), 8.73 (1H, s), 9.15 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 527 (M-1)

### 実施例 9

化合物 652 3- { [アセチル- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル (化合物A) (4.0 g) を、無水塩化メチレン (40.0 ml) に溶解させた。続いて、0℃にてピリジン (2.8 ml)、3- (クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (3.0 ml) をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステルを製造した (7.42 g, 収率100%)。

上記反応で得られた、2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル (800 mg) を、無水塩化メチレン (5.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (580 μl) N, N-ジエチルエチレンジアミン (化合物B') (464 mg) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、未精製の有用中間体である2- {3- [ (2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -ベンゾイルアミノ} -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステルを得た (902 mg、収率100%)。

上記反応で得られた、2- {3- [ (2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -ベンゾイルアミノ} -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステルを、エタノール (5.

0 ml) に溶解させ、ヒドラジーン水和物 (2 ml) を加え、加熱還流下で 15 時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮し、ヒドラジン化合物 3 - [(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-(3-ヒドラジノカルボニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル)-ベンズアミドを製造した (464 mg、収率 52%)。

3 - [(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-(3-ヒドラジノカルボニル-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル)-ベンズアミド (77 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて酢酸 (50.0  $\mu$ l)、3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物 C) (55.0  $\mu$ l) を添加し、加熱還流下で 15 時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物 652 を製造した (58.4 mg、収率 58%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (6H, m), 1.85 (7H, m), 2.28 (6H, m), 2.45-2.90 (12H, m), 3.76 (2H, m), 7.14 (1H, m), 7.32-8.12 (7H, m)

質量分析 (ESI-MS) 600 (M-1)

化合物 653 3 - { [アセチル-(2-ジエチルアミノ-エチル)-アミノ]-メチル } -N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 9 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 653 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.38 (3H, s), 2.42-2.90 (12H, m), 3.75 (2H, m), 7.24 (2H, m), 7.40-8.15 (7H, m)

質量分析 (ESI-MS) 586 (M-1)

化合物 654 3 - { [アセチル-(2-ジエチルアミノ-エチル)-アミノ]

ーメチル}ーNー[3ー(4ーフルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ー4, 5, 6, 7ーテトラヒドロベンゾ[b]チオフェンー2ーイル]ーベンズアミド

実施例9とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物654を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.93 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.48 (4H, m), 2.69 (6H, m), 2.80 (2H, m), 3.75 (2H, m), 7.06 (2H, m), 7.40ー7.95 (6H, m), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 590 (M-1)

化合物655 3ー{[アセチルー(2ージエチルアミノーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーNー[3ー(3ーフルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ー4, 5, 6, 7ーテトラヒドロベンゾ[b]チオフェンー2ーイル]ーベンズアミド

実施例9とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物655を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.94 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.62 (12H, m), 3.76 (2H, m), 7.08 (1H, m), 7.29ー8.20 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 590 (M-1)

化合物656 3ー{[アセチルー(2ージエチルアミノーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーNー[3ー(4ークロロー3ートリフルオロメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ー4, 5, 6, 7ーテトラヒドロベンゾ[b]チオフェンー2ーイル]ーベンズアミド

実施例9とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物656を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.93 (6H, m), 1.83 (7H, m), 2.62 (12H, m), 3.77 (2H, m), 7.40ー8.30 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 674 (M-1)

化合物657 3ー{[アセチルー(2ージエチルアミノーエチル)ーアミノ]ーメチル}ーNー[3ー(4ーメトキシーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ー4, 5, 6, 7ーテトラヒドロベンゾ[b]チオフェンー2ーイル]ーベンズアミド



ル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 9 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 5 7 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (6H, m), 1.87 (7H, m), 2.63 (12H, m), 3.77 (2H, m), 3.84 (3H, s), 6.89 (2H, m), 7.40-8.10 (7H, m)

質量分析 (ESI-MS) 602 (M-1)

化合物 6 5 8 N-[3-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 5 8 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.80 (2H, m), 2.30 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.53 (2H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, m), 3.85 (2H, s), 7.00 (1H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 7.18 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.52 (3H, m), 7.64 (2H, m), 7.90 (1H, s), 7.97 (1H, s), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 480 (M-1)

化合物 6 5 9 3-(3-ヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-N-[3-(4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 6 5 9 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.79 (2H, m), 2.35 (3H, s), 2.53 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 3.82 (2H, s), 6.97 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 7.21 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.49 (2H, m), 7.60 (1H, d,  $J=7.80$ ), 7.69 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.87 (1H, m), 7.94 (1H, s), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 466 (M-1)

化合物 660 N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 660 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.80 (2H, m), 2.53 (2H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.82 (2H, s), 6.96 (1H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 7.14 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.48 (2H, m), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.85 (3H, m), 7.93 (1H, s), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 470 (M-1)

化合物 661 N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 661 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.80 (2H, m), 2.54 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, t,  $J=9.4\text{ Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 7.03 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 7.17 (1H, m), 7.42-7.80 (6H, m), 7.87 (1H, m), 7.98 (1H, bs), 8.35 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 470 (M-1)

化合物 662 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- (3-ヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 662 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.80 (1H, m), 2.54 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 7.03 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 7.53 (2H, m), 7.66 (2H, m), 7.90 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.9

8 (1H, b s), 8.04 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.33 (1H, s), 8.38 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 554 ( $M-1$ )

化合物 663 3- (3-ヒドロキシープロピルスルファニルメチル) -N- [3- (4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 663 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.80 (2H, m), 2.54 (2H, t,  $J=7.3$  Hz), 3.62 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 3.85 (6H, m), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.02 (1H, s,  $J=5.9$  Hz), 7.53 (2H, m), 7.65 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.79 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.90 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.30 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 482 ( $M-1$ )

化合物 664 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 664 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.22 (9H, m), 2.62 (8H, m), 3.59 (2H, s), 6.77 (1H, d,  $J=5.4$  Hz), 7.09 (1H, m), 7.44 (5H, m), 7.94 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518 ( $M-1$ )

化合物 665 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 665 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.$

1 Hz), 2. 21 (3H, s), 2. 34 (3H, s), 2. 59 (8H, m), 3. 58 (2H, s), 6. 80 (1H, d,  $J=4.6$  Hz), 7. 16 (2H, m), 7. 42 (2H, m), 7. 58 (3H, m), 7. 93 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 98 (1H, s), 8. 28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 504 (M-1)

化合物 666 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 666 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2. 21 (3H, s), 2. 62 (8H, m), 3. 58 (2H, s), 6. 78 (1H, d,  $J=4.6$  Hz), 7. 02 (2H, m), 7. 42 (2H, m), 7. 55 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 67 (2H, m), 7. 91 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 96 (1H, s), 8. 36 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

化合物 667 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 667 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2. 20 (3H, s), 2. 60 (8H, m), 3. 57 (2H, s), 6. 76 (1H, bs), 7. 02 (1H, m), 7. 41 (6H, m), 7. 91 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 97 (1H, s), 8. 38 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 508 (M-1)

化合物 668 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 668 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.02 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.20 (3H, s), 2.58 (8H, m), 3.56 (2H, s), 6.74 (1H, bs), 7.41 (2H, m), 7.54 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.76 (1H, dd,  $J=8.3$  Hz,  $J=1.4$  Hz), 7.88 (2H, m), 7.96 (1H, s), 8.45 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 592 ( $M-1$ )

化合物 669 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 669 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.01 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.19 (3H, s), 2.56 (8H, m), 3.56 (2H, s), 3.75 (3H, s), 6.75 (1H, m), 6.81 (2H, m), 7.42 (2H, m), 7.87 (3H, m), 7.90 (1H, d,  $J=7.84$ ), 7.97 (1H, s), 8.32 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520 ( $M-1$ )

化合物 670 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 670 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, m), 2.30 (3H, s), 2.32 (3H, s), 2.52 (4H, m), 3.83 (4H, m), 7.01 (1H, d,  $J=5.8$  Hz), 7.19 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.53 (3H, m), 7.67 (2H, m), 7.93 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.06 (1H, m), 8.29 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 521 ( $M-1$ )

化合物 671 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオ

フェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 671 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.39 (3H, s), 2.52 (4H, m), 3.82 (4H, m), 7.01 (1H, m), 7.26 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.53 (2H, m), 7.68 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.74 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.92 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.06 (1H, m), 8.33 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507 ( $M-1$ )

化合物 672 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 672 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.10 (6H, d,  $J=6.3$  Hz), 2.51 (4H, m), 3.86 (4H, m), 7.02 (1H, d,  $J=5.9$  Hz), 7.18 (2H, dd,  $J=8.4$  Hz,  $J=8.4$  Hz), 7.53 (2H, m), 7.68 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz), 7.91 (3H, m), 8.06 (1H, m), 8.35 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 511 ( $M-1$ )

化合物 673 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 673 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, m), 2.52 (4H, m), 3.87 (4H, m), 7.03 (1H, d,  $J=6.1$  Hz), 7.15 (1H, m), 7.40-7.75 (6H, m), 7.90 (1H, m), 8.07 (1H, m), 8.36 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 511 ( $M-1$ )

化合物 674 3- [(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン)

ーアミノ]ー2ー(3ー{[(2ージエチルアミノーエチル)ーメチルーアミノ]ーメチル}ーフェニル)ー5, 6, 7, 8ーテトラヒドロー3Hーベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジンー4ーオン

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物674を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.99 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.90 (4H, m), 2.12 (3H, s), 2.50 (8H, m), 2.82 (2H, m), 3.05 (2H, m), 3.52 (2H, s), 7.38 (2H, m), 7.54 (2H, m), 7.62 (1H, bs), 7.78 (1H, m), 7.98 (1H, m), 9.18 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 630 ( $M+1$ )

化合物675 2ー(3ー{[(2ージエチルアミノーエチル)ーメチルーアミノ]ーメチル}ーフェニル)ー3ー[(4ーメトキシーベンジリデン)ーアミノ]ー5, 6, 7, 8ーテトラヒドロー3Hーベンゾ[4, 5]チエノ[2, 3-d]ピリミジンー4ーオン

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物675を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.00 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.89 (4H, m), 2.11 (3H, s), 2.52 (8H, m), 2.81 (2H, m), 3.06 (2H, m), 3.50 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.89 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.35 (2H, m), 7.58 (1H, m), 7.66 (3H, m), 8.77 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 558 ( $M+1$ )

化合物676 Nー[4ープロモー2ー(4ーメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ー3ー(2ーヒドロキシーエタンスルフォニルメチル)ーベンズアミド

実施例6に記載の方法に従って、表題の化合物676を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  8.58 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.34 (1H, s), 8.07 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 8.00 (2H, s), 7.23ー7.78 (3H, m), 7.57ー7.63 (2

H, m), 7.27 (2H, d,  $J=2.0$  Hz), 4.39 (1H, d,  $J=13.2$  Hz), 4.20 (1H, d,  $J=13.2$  Hz), 3.96–4.05 (2H, m), 3.00–3.15 (1H, m), 2.80–2.95 (1H, m), 2.39 (3H, s).

質量分析 (ESI-MS) 556, 558 ( $M-1$ )

**化合物 677** N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシエタンスルフィニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 677 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.61 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 8.06–8.13 (2H, m), 8.04 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.72–7.79 (4H, m), 7.60 (1H, dd,  $J=7.8$  Hz,  $J=7.8$  Hz), 7.28 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 4.83 (2H, s), 4.05 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 3.20 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 2.39 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 542, 543 ( $M-1$ )

**化合物 678** N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシエタンスルフォニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 678 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.40 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.07 (1H, d,  $J=2.0$  Hz), 8.05 (1H, s,  $J=8.5$  Hz), 7.96–8.05 (2H, m), 7.77 (1H, dd,  $J=2.0$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 7.69 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.56–7.66 (2H, m), 4.39 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 4.20 (1H, d,  $J=13.2$  Hz), 3.96–4.03 (2H, m), 3.03–3.13 (1H, m), 2.87 (1H, dt,  $J=4.2$  Hz,  $J=13.4$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 664, 646 ( $M-1$ )



化合物 679 N- [4-ブromo-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (2-ヒドロキシ-エタンスルフィニルメチル) -ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 679 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.70–8.80 (1H, m), 8.20–8.27 (1H, m), 8.05–8.15 (2H, m), 7.97 (2H, s), 7.60–7.70 (3H, m), 7.49–7.60 (2H, m), 4.52 (2H, m), 4.22–4.26 (2H, m), 3.10–3.15 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 628, 630 (M-1)

化合物 680 N- [4-クロロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (フラン-2-イルメチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 680 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.36 (1H, s), 7.93–7.97 (2H, m), 7.85–7.90 (1H, m), 7.69 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 7.63 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.58 (2H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.40–7.48 (2H, m), 7.18 (2H, m), 6.29–6.33 (1H, m), 6.21 (1H, d,  $J=3.2\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 3.64 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520, 522 (M-1)

化合物 681 N- [4-クロロ-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -3- (フラン-2-イルメチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 681 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 7.85–7.96 (5H, m), 7.62

(1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.40–7.42 (1H, m), 7.18 (2H, dd,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.31 (1H, dd,  $J=2.0\text{ Hz}$ ,  $J=3.2\text{ Hz}$ ), 6.21 (1H, d,  $J=3.2\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 3.64 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520, 522 ( $M-1$ )

化合物 682 N-[4-クロロ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 682 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 7.91–7.96 (2H, m), 7.85–7.90 (1H, m), 7.73 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.40–7.42 (1H, m), 7.26 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 6.29–6.33 (1H, m), 6.20–6.23 (1H, m), 3.82 (2H, s), 3.64 (2H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 516, 518 ( $M-1$ )

化合物 683 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 683 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.66 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s), 7.86–7.98 (3H, m), 7.48–7.78 (5H, m), 7.41 (1H, s), 7.15–7.27 (1H, m), 6.29–6.35 (1H, m), 6.20–6.25 (1H, m), 3.82 (2H, s), 3.64 (2H, s), 2.31 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 530, 532 (M-1)

化合物 684 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3,4-ジメチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-{ [ {3-[ (3-{ [4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3,4-ジメチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) プロピル] (メチル) アミノ) メチル} ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 684 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.57 (2H, s), 10.57 (2H, s), 8.67 (2H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.44 (2H, s), 7.80 (2H, s), 7.71-7.73 (2H, m), 7.64 (2H, s), 7.56 (2H, s), 7.38 (4H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.20-7.35 (4H, m), 7.10 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.53 (4H, s), 2.46 (4H, s), 2.23 (6H, s), 2.18 (6H, s), 2.14 (6H, s), 1.80 (2H, s), 1.61 (4H, s)

質量分析 (ESI-MS) 935 (M-1)

化合物 685 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-{ [ {3-[ (3-{ [4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) プロピル} (メチル) アミノ] メチル} ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 685 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.59 (2H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.40 (2H, s), 7.88-7.90 (4H, m), 7.85 (2H, s), 7.79 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.63 (2H, d,  $J=10.5\text{ Hz}$ ), 7.52-7.58 (4H, m), 7.35-7.45 (6H, m), 7.12-7.20 (2H, m), 3.62 (4H, s), 2.53 (4H, m), 2.23 (6H, s), 1.78-1.85 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 915 (M-1)

化合物 686 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフォニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 686 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.64 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.30 (1H, s), 8.01 (2H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.52-7.68 (5H, m), 7.20 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 6.50 (1H, d,  $J=3.2$  Hz), 6.42-6.45 (1H, m), 4.25-4.37 (2H, m), 4.11 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 4.08 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562, 564 (M-1)

化合物 687 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフィニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 687 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  6.37 (1H, s), 8.72 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.00-8.22 (3H, m), 7.40-7.80 (7H, m), 6.54 (1H, d,  $J=3.4$  Hz), 6.40-6.45 (1H, m), 4.29 (2H, s), 4.20 (2H, s), 2.29 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 546, 548 (M-1)

化合物 688 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフォニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 688 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.60 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.39 (1H, s), 8.32 (1H, s), 7.89-8.07

(4 H, m), 7. 55–7. 73 (5 H, m), 6. 49 (1 H, m), 6. 41–6. 46 (1 H, m), 4. 31 (2 H, dd,  $J=13.4$  Hz,  $J=15.8$  Hz), 4. 09 (2 H, dd,  $J=10.0$  Hz,  $J=14.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 636, 638 (M-1)

化合物 689 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメタンスルフィニルメチル)-ベンズアミド

実施例 6 に記載の方法に従って、表題の化合物 689 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8. 60 (1 H, d,  $J=9.3$  Hz), 8. 39 (1 H, s), 8. 32 (1 H, s), 7. 98–8. 09 (3 H, m), 7. 94 (1 H, d,  $J=2.2$  Hz), 7. 69 (2 H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 56–7. 67 (3 H, m), 6. 55 (1 H, d,  $J=3.2$  Hz), 6. 40–6. 47 (1 H, m), 4. 54 (2 H, s), 4. 51 (2 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 620 (M-1)

化合物 690 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル) フェニル)-3-{ [ {6-[ (3-{ [4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) ヘキシル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 690 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 1125, 1127 (M-1)

化合物 691 2-{3-[4-クロロ-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニルカルバモイル]-ベンジルスルファニル}-エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 691 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8. 53 (1 H, d,  $J=9.$

0 Hz), 8.34 (1H, s), 7.40–8.00 (10, m), 4.84 (2H, s), 2.90–3.10 (2H, m), 2.70–2.86 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 548 (M-1)

化合物 692 2- {3- [4-クロロ-2- (3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 692 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.20–8.35 (11H, m), 3.84–3.90 (2H, m), 2.92–3.04 (2H, m), 2.70–2.88 (2H, m), 2.30–2.40 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 544 (M-1)

化合物 693 2- {3- [4-クロロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 693 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.55 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.32 (1H, s), 7.10–8.00 (10H, m), 3.88 (2H, s), 2.90–3.10 (2H, m), 2.68–2.86 (2H, m), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 544 (M-1)

化合物 694 2- {3- [4-クロロ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 694 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.56 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.46–8.00 (8H, m), 7.18–7.25 (1H, m), 3.87 (2H, s), 2.94–3.10 (2H,

m), 2.75–2.86 (2H, m), 2.25–2.35 (6H, m).

質量分析 (ESI-MS) 582 (M+23)

化合物 695 6-ブロモ-3-[(4-フルオロベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(2-ヒドロキシエチルスルファニルメチル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 10 に記載の方法に従って、表題の化合物 695 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.98–9.00 (1H, m), 8.46 (1H, s), 7.85 (1H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.65–7.72 (3H, m), 7.58 (1H, dd,  $J=1.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.35–7.43 (2H, m), 7.07–7.13 (3H, m), 3.73 (2H, s), 3.56–3.64 (2H, m), 2.52–2.58 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 534, 536, 537 (M+23)

化合物 696 6-ブロモ-2-[3-(2-ヒドロキシエチルスルファニルメチル)-フェニル]-3-[(4-メチルベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 10 に記載の方法に従って、表題の化合物 696 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.85 (1H, s), 8.41 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.91 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.79 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.59–7.64 (2H, m), 7.52–7.56 (3H, m), 7.28–7.36 (2H, m), 7.14–7.20 (1H, m), 3.67 (2H, s), 3.49 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.46 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.36 (1H, s), 2.33 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 530, 532, 533 (M+23)

化合物 697 6-ブロモ-3-[(3,4-ジメチルベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(2-ヒドロキシエチルスルファニルメチル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 10 に記載の方法に従って、表題の化合物 697 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.78 (1H, s), 8.41 (2H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.79 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.64 (1H, s), 7.60 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.53–7.57 (1H, m), 7.42 (1H, s), 7.28–7.38 (3H, m), 7.11 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.67 (2H, s), 3.49 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.46 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.24 (3H, s), 2.22–2.27 (1H, m), 2.20 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 546, 547 ( $M+23$ )

化合物 698 6-ブromo-3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-フェニル]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 10 に記載の方法に従って、表題の化合物 698 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.27 (1H, s), 8.46 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.94 (1H, s), 7.86 (1H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.75 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.65–7.68 (2H, m), 7.54 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.32–7.45 (2H, m), 3.75 (2H, s), 3.61 (2H, dt,  $J=5.9\text{ Hz}$ ,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 2.57 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.03 (1H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 620 ( $M+23$ )

化合物 699 N-[4-クロロ-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 699 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.65 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.34 (1H, s), 7.91–7.96 (2H, m), 7.85–7.90 (1H, m), 7.69 (1H, s), 7.61 (2H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.



4.9 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.41 (1H, dd,  $J=0.8\text{ Hz}$ ,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 7.24–7.34 (2H, m), 6.30 (1H, dd,  $J=2.0\text{ Hz}$ ,  $J=3.2\text{ Hz}$ ), 6.21 (1H, d,  $J=3.2\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 3.63 (2H, s), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 516, 518 ( $M-1$ )

化合物 700 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(フラン-2-イルメチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 5 に記載の方法に従って、表題の化合物 700 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.62 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 8.31 (1H, s), 8.04 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.92–7.96 (2H, m), 7.87 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.69 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.64 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.40 (1H, dd,  $J=0.8\text{ Hz}$ ,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 6.28–6.33 (1H, m), 6.21 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 3.64 (2H, s)

質量分析 (ESI-MS) 604, 606 ( $M-1$ )

化合物 701 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(4-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ } カルボニル } フェニル ) -3- { [ {3-[ (3- { [4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(4-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ } カルボニル } アニリノ } カルボニル } ベンジル ) (メチル) アミノ } プロピル ) (メチル) アミノ ] メチル } ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 701 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.59 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.41 (2H, s), 7.82–7.90 (8H, m), 7.79 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.53 (2H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=$

9. 0 Hz), 7. 35-7. 45 (4H, m), 7. 14 (4H, dd, J=8. 8 Hz, J=8. 8 Hz), 3. 59 (4H, s), 2. 49 (4H, t, J=6. 8 Hz), 2. 20 (6H, s), 1. 75-1. 85 (2H, m)  
 質量分析 (ESI-MS) 915, 917 (M-1)

化合物 702 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(4-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル)-3-{ [ {3-[ (3-{ [4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(4-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) プロピル) (メチル) アミノ] メチル} ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 702 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8. 66 (2H, d, J=9. 0 Hz), 8. 46 (2H, s), 7. 72-7. 82 (4H, m), 7. 58-7. 68 (6H, m), 7. 25-7. 40 (4H, m), 7. 12-7. 16 (6H, m), 3. 53 (4H, bs), 2. 46 (4H, bs), 2. 15 (6H, bs), 1. 81 (2H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 907, 909 (M-1)

#### 実施例 10

化合物 703 2-(3-{6-クロロ-3-[ (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン) -アミノ]-4-オキソ-3, 4-ジヒドロキナゾリン-2-イル}-ベンジルスルファニル)-エタンスルフォニック アシッド

メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート (化合物 A) (4. 0 g) を、無水塩化メチレン (80. 0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2. 8 ml)、3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (5. 0 g) をそれぞれ加え、同温度にて 2 時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-クロロ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (3. 32 g, 収率 100%) を得た。

続いて、メチル 5-クロロ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミ

ノベンゾエート (1.8 g) を、無水塩化メチレンに溶解させ、室温にてトリエチルアミン (1.5 ml)、2-メルカプトエタンスルフォニックアシッドナトリウムソルト (化合物 B') (1.3 g) を加え、40℃にて4日間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、有用中間体である 5-クロロ-2-[3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.08 g、収率 46.1%) を得た。

上記反応で得られた、5-クロロ-2-[3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.08 g) を、エタノール (11.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (1.0 ml) を加え、加熱還流下で3日間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷した後、反応液をそのまま濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、キナゾロン化合物である 2-[3-(3-アミノ-6-クロロ-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-2-イル)-ベンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (542 mg、収率 52.1%) を得た。

2-[3-(3-アミノ-6-クロロ-4-オキソ-3,4-ジヒドロキナゾリン-2-イル)-ベンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (50.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて、4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (化合物 C) (50.0  $\mu$ l) を添加し、加熱還流下にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物 703 (32.0 mg、収率 44.0%) を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  9.16 (1H, s), 8.1

5-8. 25 (1H, m), 7. 38-7. 90 (9H, m), 3. 84 (2H, s), 2. 97-3. 05 (2H, m), 2. 80-2. 87 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 614, 616 (M-1)

化合物704 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-{ [ {6-[ (3-{ [4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3-フルオロフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) ヘキシル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物704を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  8. 60 (2H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8. 35 (2H, s), 7. 88-7. 95 (4H, m), 7. 30-7. 80 (14H, m), 7. 10-7. 20 (2H, m), 3. 69 (4H, s), 2. 47 (4H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 2. 27 (6H, s), 1. 50-1. 60 (4H, m), 1. 25-1. 37 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 957 (M-1)

化合物705 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} -3-{ [ {6-[ (3-{ [4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(3-メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) ヘキシル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物705を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  8. 61 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8. 35 (2H, s), 7. 85-7. 93 (4H, s), 7. 63 (2H, s), 7. 45-7. 57 (10H, m), 7. 14-7. 30 (4H, m), 3. 58 (4H, s), 2. 35-2. 45 (4H, m), 2. 34 (6H, s), 2. 18 (6H, s), 1. 53 (4H, bs), 1. 32 (4H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 949 (M-1)

化合物706 N1-[4-クロロ-2-( {2-[ (E)-1-(4-メチル

フェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} フェニル} - 3 - { [ {6 - [ (3 - { [4 - クロロ - 2 - ( {2 - [ (E) - 1 - (4 - メチルフェニル) メチリデン] ヒドラジノ} カルボニル} アニリノ} カルボニル} ベンジル} (メチル) アミノ) ヘキシル) (メチル) アミノ] メチル] ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 706 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.60 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.34 (2H, s), 7.83-7.98 (8H, m), 7.66 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.48-7.60 (4H, m), 7.21 (6H, d,  $J=7.8$  Hz), 3.78 (4H, s), 2.55-2.60 (4H, m), 2.30-2.35 (12H, m), 1.59 (4H, bs), 1.35 (4H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 949 (M-1)

化合物 707 3 - { [ビス - (2 - ヒドロキシープロピル) - アミノ] - メチル} - N - [2 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - 4 - メチル - チオフェン - 3 - イル] - ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 707 を製造した。

質量分析 (ESI-MS) 609, 611, 612 (M-1)

化合物 708 2 - {3 - [4 - クロロ - 2 - (4 - フルオロ - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニルカルバモイル] - ベンジルスルファニル} - エタンスルフォニック アシッド

実施例 11 に記載の方法に従って、表題の化合物 708 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.54 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.34 (1H, s), 7.98 (1H, s), 7.35-7.92 (7H, m), 7.14-7.22 (2H, m), 3.88 (2H, s), 2.95-3.06 (2H, m), 2.70-2.86 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 548 (M-1)

#### 実施例 11

化合物 709 2 - {3 - [4 - クロロ - 2 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチル - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニルカルバモイル] - ベ

ンジルスルファニル}-エタンスルフォニック アシッド

メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート (化合物A) (4.0 g) を、無水塩化メチレン (80.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にてピリジン (2.8 ml)、3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (5.0 g) をそれぞれ加え、同温度にて2時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、有用中間体である、メチル 5-クロロ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (3.32 g, 収率100%) を得た。

続いて、メチル 5-クロロ-2-[3-(クロロメチル) ベンゾイル] アミノベンゾエート (1.8 g) を、無水塩化メチレンに溶解させ、室温にてトリエチルアミン (1.5 ml)、2-メルカプトエタンスルフォニックアシッドナトリウムソルト (化合物B') (1.3 g) を加え、40℃にて4日間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、有用中間体である5-クロロ-2-[3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.08 g, 収率46.1%) を得た。

上記反応で得られた、5-クロロ-2-[3-(2-スルフォーエチルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-ベンゾイックアシッドメチルエステル (1.27 g) を、エタノール (15.0 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン-水和物 (2.0 ml) を加え、40℃にて12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を室温にて放冷した後、反応液をそのまま濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、ヒドラジン化合物である 2-[3-(4-クロロ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニルカルバモイル)-ベンンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (820 mg, 収率67.2%) を得た。

2-[3-(4-クロロ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニルカルバモイ

ル) -ベンジルスルファニル]-エタンスルフォニックアシッド (50.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させた。続いて、室温にて、4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (化合物C) (50.0  $\mu$ l) を添加し、加熱還流下にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和塩化ナトリウム水溶液、飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行ない、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製し、真空ポンプにて乾燥させる事により、表題の化合物709 (47.2 mg、収率56.0%) を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.52 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.38–8.40 (10H, m), 3.89 (2H, s), 2.94–3.06 (2H, m), 2.70–2.88 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 632 ( $M-1$ )

化合物710 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [4-メチルー2- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物710を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.18 (1H, bs), 7.88–8.03 (3H, m), 7.64–7.70 (2H, m), 7.59 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.46–7.55 (1H, m), 7.25 (2H, bs), 3.64 (2H, s), 2.72 (2H, bs), 2.53–2.65 (6H, m), 2.37 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.04 (6H, t,  $J=7.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 520 ( $M+1$ )

化合物711 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例8に記載の方法に従って、表題の化合物711を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  7.88–8.18 (3H,

m), 7.37-7.64 (5H, m), 7.19 (1H, s), 3.63 (2H, s), 2.67-2.75 (2H, m), 2.53-2.65 (6H, m), 2.20-2.35 (12H, m), 0.98-1.10 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 532 (M-1), 534 (M+1)

化合物 712 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 712 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  7.90-8.03 (3H, m), 7.72 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.38-7.56 (2H, m), 6.97 (2H, bs), 3.84 (2H, s), 3.64 (2H, s), 2.67-2.75 (2H, m), 2.53-2.65 (6H, m), 2.27 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.00-1.10 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1), 536 (M+1)

化合物 713 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [ (2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 713 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.43 (2H, bs), 7.99 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.68 (1H, s), 7.36-7.60 (6H, m), 7.13 (1H, ddd,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 3.89 (2H, s), 3.68-3.73 (4H, m), 2.72 (2H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 2.53 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.43 (4H, t,  $J=4.4\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 582 (M-1)

化合物 714 N- [4-ブromo-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [ (2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド



実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 714 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.51 (1H, s), 8.31 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.65 (1H, s), 7.58 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.47 (3H, d,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 3.89 (2H, s), 3.71 (4H, t,  $J=4.5\text{Hz}$ ), 2.71 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 2.53 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 2.43 (4H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 664, 666 ( $M-1$ )

化合物 715 N-[4-プロモ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 715 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.43 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.38 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=8.1\text{Hz}$ ), 7.68-7.77 (3H, m), 7.48 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.41 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.90 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 3.81 (3H, s), 3.68-3.72 (4H, m), 2.69 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 2.51 (2H, t,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 2.38-2.45 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 592 ( $M-1$ )

化合物 716 N-[4-プロモ-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 716 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.40-8.46 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.71 (1H, s), 7.49 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.42 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.35 (1H, s), 7.30 (2H, d,  $J=5.6\text{Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.70 (4H, t,  $J=4.6\text{Hz}$ ), 2.6

9 (2H, t,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 2.51 (2H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 2.40–2.47 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 596 ( $M+1$ )

化合物 717 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(4-フルオロ-フェニル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 717 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.57 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.28 (1H, s), 8.00 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.55–7.73 (3H, m), 7.48 (3H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.18 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 6.93–6.98 (2H, m), 6.85–6.90 (2H, m), 3.63 (2H, s), 3.13 (4H, t,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 2.62 (4H, bs), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 642 ( $M-1$ )

化合物 718 4-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブromo-2-(3-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 718 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.53 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 8.02 (2H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.70 (2H, s), 7.53–7.60 (2H, m), 7.45 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.32 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ ,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 3.60–3.99 (4H, m), 2.42–2.66 (4H, m), 2.39 (3H, s), 1.12 (6H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 581 ( $M+1$ )

化合物 719 4-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 719 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.53 (1H, bs), 8.37 (1H, bs), 8.00 (2H, bs), 7.81 (2H, bs), 7.70 (1H, bs), 7.40–7.60 (3H, m), 7.05–7.15 (2H, m), 3.83–3.98 (2H, m), 3.65–3.78 (2H, m), 2.45–2.60 (4H, m), 1.20–1.30 (3H, m), 1.06–1.16 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 587 ( $M+1$ )

化合物 720 4- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 720 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.45–8.54 (1H, m), 8.39 (1H, s), 8.00 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.36–7.74 (7H, m), 7.10–7.20 (1H, m), 3.80–4.02 (4H, m), 2.47–2.60 (4H, m), 1.12 (6H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 585 ( $M+1$ )

化合物 721 4- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 721 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.46 (2H, bs), 7.95–8.08 (3H, m), 7.45–7.75 (4H, m), 7.13–7.20 (2H, m), 3.60–4.03 (4H, m), 2.47–2.68 (4H, m), 1.12 (6H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 667, 669 ( $M-1$ )

化合物 722 4- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカル

ボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 722 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.37–8.47 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.70–7.74 (3H, m), 7.38–7.53 (3H, m), 6.90 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.77–3.95 (4H, m), 3.81 (3H, s), 2.42–2.64 (4H, m), 1.08–1.14 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 597 ( $M+1$ )

化合物 723 4- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-プロモ-2- (3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 723 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.57 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.34 (1H, s), 8.00 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.72 (1H, s), 7.55–7.62 (1H, m), 7.46 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.30–7.40 (3H, m), 6.95–7.02 (1H, m), 3.80–4.00 (4H, m), 3.86 (3H, s), 2.40–2.65 (4H, m), 1.09–1.15 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 597 ( $M-1$ )

化合物 724 N- [4-プロモ-2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- ( { [2-ヒドロキシ-2- (4-ヒドロキシ-フェニル) -エチル] -メチル-アミノ } -メチル) -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 724 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.56–8.66 (1H, m), 7.96 (2H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.87 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.65–7.78 (3H, m), 7.46–7.56 (3H, m), 7.13–7.22 (3H, m), 6.72–6.78 (2H, m), 4.80–4.90 (1H, m), 3.75–3.90 (2H, m), 2.73–2.82 (1H, m), 2.58–2.66 (1H, m), 2.

4.0–2.45 (3H, m), 2.28–2.32 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 629 (M-1)

化合物 725 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-({[2-ヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシフェニル)-エチル]-メチル-アミノ}-メチル)-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 725 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.61 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.36 (1H, s), 8.07 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.92 (2H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.56 (1H, dd,  $J=2.2$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 7.70 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.42–7.49 (3H, m), 7.10–7.24 (3H, m), 6.75 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 4.70–4.75 (1H, m), 3.68 (2H, d,  $J=4.4$  Hz), 2.67 (1H, dd,  $J=12.7$  Hz,  $J=8.5$  Hz), 2.50 (1H, dd,  $J=4.9$  Hz,  $J=12.7$  Hz), 2.33 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 619 (M-1)

化合物 726 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-({[2-ヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシフェニル)-エチル]-メチル-アミノ}-メチル)-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 726 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.61 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.40 (1H, s), 8.34 (1H, s), 8.04–8.10 (2H, m), 7.90–7.95 (2H, m), 7.77 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.4$  Hz), 7.69 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.45 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.13 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 6.75 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 4.70–4.80 (1H, m), 3.70 (2H, d,  $J=4.4$  Hz), 2.68 (1H, dd,  $J=8.3$  Hz,  $J=12.8$  Hz), 2.52 (1H, dd,  $J=4.6$  Hz,  $J=12.7$  Hz)

z), 2.36 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 701, 703 (M-1)

化合物 727 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-({[2-ヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシフェニル)-エチル]-メチル-アミノ}-メチル)-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 727 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.63 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 8.07 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.94 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.75 (1H, dd,  $J=8.8$  Hz,  $J=2.2$  Hz), 7.61 (1H, bs), 7.44 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.26-7.36 (2H, m), 7.13 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 6.97-7.03 (1H, m), 6.76 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 4.72-4.82 (1H, m), 3.84 (3H, s), 3.76 (2H, d,  $J=5.8$  Hz), 2.72 (1H, dd,  $J=8.6$  Hz,  $J=13.0$  Hz), 2.41 (3H, s), 2.57 (1H, dd,  $J=4.9$  Hz,  $J=13.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 629 (M-1)

化合物 728 N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 728 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.49 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.41 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.73 (1H, s), 7.68 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.51 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.41 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.19-7.23 (3H, m), 3.47-3.75 (10H, m), 3.16 (2H, s), 2.40-2.56 (8H, m), 2.36 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 659 (M-1)

化合物 729 N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジ

ノカルボニル) - フェニル] - 4 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチル) - ピペラジン - 1 - イルメチル] - ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 729 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.48 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.42 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.66 - 7.75 (2H, m), 7.49 - 7.56 (2H, m), 7.41 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.20 - 7.32 (2H, m), 3.48 - 3.76 (10H, m), 3.16 (2H, s), 2.40 - 2.56 (8, m), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 661 (M-1)

化合物 730 N - [4 - プロモ - 2 - (4 - フルオロ - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 4 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチル) - ピペラジン - 1 - イルメチル] - ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 730 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.48 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.43 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.76 - 7.87 (2H, m), 7.68 - 7.73 (1H, m), 7.49 - 7.57 (1H, m), 7.42 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.11 (2H, dd,  $J=8.5$  Hz,  $J=8.5$  Hz), 3.49 - 3.76 (10H, m), 3.16 (2H, s), 2.40 - 2.65 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 665 (M-1)

化合物 731 N - [4 - プロモ - 2 - (3 - フルオロ - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - 4 - [4 - (2 - モルホリン - 4 - イル - 2 - オキソ - エチル) - ピペラジン - 1 - イルメチル] - ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 731 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.42 - 8.52 (2H, m), 7.96 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.73 (1H, s), 7.46 - 7.60 (3H, m), 7.33 - 7.44 (3H, m), 7.11 (1H, ddd,  $J=2.4$  Hz,  $J=8.3$  Hz,  $J=8.3$  Hz), 3.48 - 3.

7.6 (10H, m), 3.15 (2H, s), 2.40–2.60 (8H, m)  
質量分析 (ESI-MS) 665 (M-1)

化合物 732 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-モルホリン-4-イル-2-オキソエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 732 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.50 (2H, s,  $J=9.0$  Hz), 8.45 (1H, s), 7.95 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.78 (1H, s), 7.51 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.25–7.43 (3H, m), 6.90–7.00 (2H, m), 3.83 (3H, s); 3.48–3.75 (10H, m), 3.16 (2H, s), 2.40–2.60 (8H, m)

質量分析 (ESI-MS) 675, 677 (M-1)

化合物 733 4-{[ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 733 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.36–8.46 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.66 (2H, d,  $J=10.0$  Hz), 7.45–7.51 (4H, m), 7.17 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 3.79 (2H, s), 3.52 (4H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.46 (4H, q,  $J=7.0$  Hz), 2.76 (4H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.29 (3H, s), 2.27 (3H, s), 1.19 (6H, t,  $J=7.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 622, 624 (M-1)

化合物 734 4-{[ビス-(2-エトキシエチル)-アミノ]-メチル}-N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 734 を製造した。



$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.45 (1H, s), 8.36 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.98 (2H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.65–7.71 (3H, m), 7.45–7.48 (3H, m), 7.20 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 3.79 (2H, s), 3.53 (4H, t,  $J=6.2\text{Hz}$ ), 3.46 (4H, q,  $J=7.9\text{Hz}$ ), 2.76 (4H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 2.35 (3H, s), 1.19 (6H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 607, 609 ( $M-1$ )

化合物 735 4- { [ビス- (2-エトキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 735 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.47 (1H, s), 8.34 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.98 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.68 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.54 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.42–7.50 (3H, m), 7.20–7.34 (2H, m), 3.78 (2H, s), 3.52 (4H, t,  $J=6.1\text{Hz}$ ), 3.46 (4H, q,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 2.76 (4H, t,  $J=6.2\text{Hz}$ ), 2.38 (3H, s), 1.19 (6H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 609 ( $M-1$ )

化合物 736 4- { [ビス- (2-エトキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 736 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.48 (1H, s), 8.31 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.98 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.81 (2H, dd,  $J=6.5\text{Hz}$ ,  $J=6.5\text{Hz}$ ), 7.64 (1H, s), 7.42–7.51 (3H, m), 7.10 (2H, dd,  $J=8.7\text{Hz}$ ,  $J=8.7\text{Hz}$ ), 3.79 (2H, s), 3.53 (4H, t,  $J=6.2\text{Hz}$ )

z), 3.67 (4H, q,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 2.76 (4H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.19 (6H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 635 ( $M+23$ )

化合物 737 4- { [ビス- (2-エトキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 737 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{ MHz}$ ) :  $\delta$  8.50 (1H, s), 8.29 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.98 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.30-7.76 (7H, m), 7.11 (1H, ddd,  $J=2.0\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 3.80 (2H, s), 3.53 (4H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 3.47 (4H, q,  $J=6.2\text{ Hz}$ ); 2.76 (4H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 1.19 (6H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 635 ( $M+23$ )

化合物 738 4- { [ビス- (2-エトキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 738 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{ MHz}$ ) :  $\delta$  8.55 (1H, s), 8.24 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.07 (1H, s), 7.95-8.04 (3H, m), 7.62 (1H, s), 7.57 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.50 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.43 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 3.53 (4H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.47 (4H, q,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 2.76 (4H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 1.19 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 721 ( $M+23$ )

化合物 739 4- { [ビス- (2-エトキシエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-ブロモ-2- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 739 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.53 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.35–8.45 (1H, m), 7.96 (2H, dd,  $J=7.6$  Hz, 7.6 Hz), 7.75 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.67 (1H, s), 7.53 (1H, ddd,  $J=1.9$  Hz,  $J=8.8$  Hz,  $J=8.8$  Hz), 7.42–7.50 (3H, m), 5.92 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.83 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.52 (4H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.46 (4H, q,  $J=7.1$  Hz), 2.75 (4H, t,  $J=5.5$  Hz), 1.19 (6H, t,  $J=7.1$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 625 ( $M-1$ )

化合物 740 4- { [ビス- (2-エトキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-プロモ-2- (3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 740 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.47 (1H, s), 8.36 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.97 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.68 (1H, s), 7.47 (3H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.37 (1H, s), 7.27–7.34 (2H, m), 6.92–6.98 (1H, m), 3.85 (3H, s), 3.78 (2H, s), 3.52 (4H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.46 (4H, q,  $J=7.0$  Hz), 2.75 (4H, t,  $J=6.0$  Hz), 1.18 (6H, t,  $J=7.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 649 ( $M+23$ )

化合物 741 N- [4-プロモ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [4- (2-ヒドロキシ-エチル) -ピペリジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 741 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.51 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.41 (1H, s), 8.09 (1H, d,  $J=2.2$  Hz), 7.89 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.81 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz)

z,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.65 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.49 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.29 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3.52 (2H, bs), 3.38–3.46 (2H, m), 2.78 (2H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 2.36 (3H, s), 1.92 (2H, t,  $J=11.1\text{ Hz}$ ), 1.61 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.30–1.40 (3H, m), 1.10–1.20 (2H, m)  
質量分析 (ESI-MS) 577 (M-1)

化合物 742 N-[4-ブromo-2-(3-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 742 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400MHz) :  $\delta$  8.51 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.41 (1H, s), 8.10 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.88 (2H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.81 (1H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, s), 7.53 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.49 (3H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.36 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.28 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3.52 (2H, bs), 3.38–3.45 (2H, m), 2.77 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 2.37 (3H, s), 1.92 (2H, t,  $J=10.6\text{ Hz}$ ), 1.60 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.30–1.40 (3H, m), 1.10–1.21 (2H, m)  
質量分析 (ESI-MS) 575 (M-1)

化合物 743 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 743 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400MHz) :  $\delta$  8.50 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.45 (1H, s), 8.09 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.88 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.78–7.85 (3H, m), 7.

4.9 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.32 (2H, dd,  $J=8.8\text{ Hz}$ ,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3.52 (2H, bs), 3.38–3.45 (2H, m), 2.77 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 1.92 (2H, t,  $J=10.7\text{ Hz}$ ), 1.60 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.30–1.40 (3H, m), 1.10–1.20 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 581 ( $M-1$ )

化合物 744 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 744 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.49 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.44 (1H, s), 8.09 (1H, d,  $J=2.2\text{ Hz}$ ), 7.88 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.78–7.84 (1H, m), 7.47–7.63 (5H, m), 7.25–7.35 (1H, m), 4.27 (1H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3.52 (2H, s), 3.35–3.46 (2H, m), 2.77 (2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 1.92 (2H, dd,  $J=11.0\text{ Hz}$ ,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 1.61 (2H, d,  $J=11.7\text{ Hz}$ ), 1.30–1.40 (3H, m), 1.08–1.22 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 580 ( $M-1$ )、583 ( $M+1$ )

化合物 745 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペリジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 745 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.49 (1H, s), 8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.18 (1H, s), 8.05–8.10 (2H, m), 7.88 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.79–7.85 (2H, m), 7.49 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, bs), 3.52 (2H, bs), 3.38–3.45 (2H, m), 2.78

(2H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 1.86–2.00 (2H, m), 1.60  
 (2H, d,  $J=12.2\text{ Hz}$ ), 1.30–1.40 (3H, m), 1.08  
 –1.22 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 667 ( $M+1$ )

化合物 746 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラ  
 ジノカルボニル)-フェニル]-4-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペ  
 リジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 746 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.48 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.42 (1H, s), 8.09 (1H, d,  $J=2.0\text{ Hz}$ ),  
 7.88 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.78–7.83 (1H, m), 7.  
 49 (2H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.39 (1H, dd,  $J=7.8\text{ Hz}$ ,  
 $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.28–7.33 (2H, m), 7.00–7.07 (1  
 H, m), 4.29 (1H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 3.82 (3H, s), 3.  
 52 (2H, bs), 3.37–3.46 (2H, m), 2.77 (2H, d,  
 $J=10.8\text{ Hz}$ ), 1.86–1.98 (2H, m), 1.60 (2H, d,  
 $J=12.2\text{ Hz}$ ), 1.30–1.40 (3H, m), 1.08–1.22  
 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 593 ( $M-1$ )

化合物 747 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル  
 -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[ (2-モルホリ  
 ン-4-イル-1-フェニル-エチルアミノ) -メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 747 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl $_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.51 (1H, s), 8.3  
 3 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d,  
 $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.65 (1H, bs), 7.58 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ),  
 7.49 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.26–7.43 (7H,  
 m), 3.84 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 3.64–3.78 (6H,  
 m), 3.57 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 2.43–2.60 (3H,

m), 2.29–2.40 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 742 (M-1)

化合物 748 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-モルホリン-4-イル-1-フェニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 748 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.44 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.37 (1H, s), 7.99 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.74 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.69 (1H, s), 7.50 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.34–7.42 (6H, m), 7.26–7.32 (1H, m), 6.91 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.80–3.85 (1H, m), 3.82 (3H, s), 3.60–3.76 (5H, m), 3.50–3.57 (1H, m), 2.40–2.60 (3H, m), 2.28–2.34 (3H, m)

質量分析 (ESI-MS) 668 (M-1)

化合物 749 6-ブromo-2-{4-[(1,2-ジエチルピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3-[(3,4-ジメチルベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 749 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.89 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.73 (1H, s), 8.57 (1H, s), 8.03 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.40–7.82 (5H, m), 7.10–7.25 (1H, m), 3.91 (2H, s), 3.56–3.70 (1H, m), 3.15–3.27 (2H, m), 2.70–2.85 (6H, m), 2.34 (6H, s), 1.11 (6H, t,  $J=7.1$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 589 (M+1)

化合物 750 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチルピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 750 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.42 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.38 (1H, s), 7.99 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.70 (1H, s), 7.62 (1H, s), 7.40–7.52 (4H, m), 7.15 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 3.83 (2H, s), 3.56 (1H, tt,  $J=6.5$  Hz,  $J=6.5$  Hz), 3.12–3.20 (2H, m), 2.65–2.74 (6H, m), 2.28 (3H, s), 2.26 (3H, s), 1.09 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 605 ( $M-1$ )

化合物 751 6-ブromo-2-{4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3-[(3-フルオロ-ベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 751 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.90 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.74 (1H, s), 8.59 (1H, s), 8.02 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.42–7.65 (6H, m), 7.21 (1H, ddd,  $J=1.7$  Hz,  $J=8.3$  Hz,  $J=8.3$  Hz), 3.89 (2H, s), 3.62 (1H, tt,  $J=6.4$  Hz,  $J=6.4$  Hz), 3.15–3.23 (2H, m), 2.65–2.80 (6H, m), 1.10 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

化合物 752 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 752 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.46 (1H, s), 8.34 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.99 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.66 (1H, s), 7.34–7.62 (6H, m), 7.11 (1H, ddd,  $J=2.0$  Hz,  $J=8.3$  Hz,  $J=8.3$  Hz), 3.85 (2H, s), 3.57 (1H, tt,  $J=6.5$  Hz,  $J=6.5$  Hz), 3.12–3.2



0 (2H, m), 2.64–2.74 (6H, m), 1.10 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 595 ( $M-1$ )

化合物 753 6-ブromo-3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-{4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 753 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  8.88 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.75 (1H, s), 8.58 (1H, s), 7.92–8.05 (2H, m), 7.45–7.70 (6H, m), 3.89 (2H, s), 3.54–3.65 (1H, m), 3.12–3.22 (2H, m), 2.65–2.76 (6H, m), 1.10 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ).

質量分析 (ESI-MS) 663 ( $M-1$ )

化合物 754 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 754 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz): 8.51 (1H, s), 8.31 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.65 (1H, s), 7.58 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.47 (3H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 3.58 (1H, tt,  $J=6.3\text{ Hz}$ ,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.12–3.20 (2H, m), 2.65–2.75 (6H, m), 1.10 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 681 ( $M+1$ )

化合物 755 6-ブromo-2-{4-[(1,2-ジエチル-ピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-フェニル}-3-[(4-メトキシ-ベンジリデン)-アミノ]-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 755 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) : 8.89 (1H, d,  $J=8.5\text{Hz}$ ), 8.71 (1H, s), 8.58 (1H, s), 8.03 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.79 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=2.2\text{Hz}$ ), 7.57 (1H, s), 7.49 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.00 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 3.89 (5H, s), 3.62 (1H, tt,  $J=6.2\text{Hz}$ ,  $J=6.2\text{Hz}$ ), 3.15–3.25 (2H, m), 2.65–2.80 (6H, m), 1.11 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

化合物 756 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(1,2-ジエチルピラゾリジン-4-イルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 756 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) : 8.46 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.37 (1H, s), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.67–7.76 (3H, m), 7.49 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.42 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 6.91 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 3.83 (2H, s), 3.82 (3H, s), 3.57 (1H, tt,  $J=6.3\text{Hz}$ ,  $J=6.3\text{Hz}$ ), 3.12–3.20 (2H, m), 2.65–2.75 (6H, m), 1.10 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 607 ( $M-1$ )

化合物 757 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチルフェニルアミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 757 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) : 8.35–8.45 (2H, m), 7.96 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.71 (1H, s), 7.60 (1H, s), 7.43–7.48 (2H, m), 7.40 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.17–7.23 (2H, m), 7.14 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 6.65–6.73 (3H, m), 3.83 (2H, s), 3.38 (2

H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.89 (3H, s), 2.68 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 2.26 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.81 (2H, tt,  $J=7.1\text{ Hz}$ ,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 626 ( $M-1$ ), 628 ( $M+1$ )

化合物 758 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 758 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.37–8.44 (2H, m), 7.92–7.79 (2H, m), 7.64–7.72 (3H, m), 7.45 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.39 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.16–7.23 (4H, m), 6.65–6.74 (3H, m), 3.82 (2H, s), 3.39 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.89 (3H, s), 2.67 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.34 (3H, s), 1.80 (2H, tt,  $J=7.0\text{ Hz}$ ,  $J=7.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 612 ( $M-1$ ), 614 ( $M+1$ )

化合物 759 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 759 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.37–8.46 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.81 (2H, bs), 7.66 (1H, s), 7.50 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.43 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.19–7.24 (2H, m), 7.11 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 6.66–6.75 (3H, m), 3.84 (2H, s), 3.41 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.92 (3H, s), 2.69 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.81 (2H, tt,  $J=7.0\text{ Hz}$ ,  $J=7.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 616 ( $M-1$ ), 618 ( $M+1$ )

化合物 760 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 760 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.45 (1H, bs), 8.34 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.34-7.67 (7H, m), 7.18-7.25 (2H, m), 7.11 (1H, ddd,  $J=1.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 6.72 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 6.68 (1H, dd,  $J=7.2\text{ Hz}$ ,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 3.84 (2H, s), 3.41 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.91 (3H, s), 2.68 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.80 (2H, tt,  $J=7.0\text{ Hz}$ ,  $J=7.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 614 ( $M-1$ ), 618 ( $M+1$ )

化合物 761 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 761 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.50 (1H, s), 8.27 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, s), 7.99 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.63 (1H, bs), 7.56 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.19-7.25 (2H, m), 6.65-6.75 (5H, m), 3.85 (2H, s), 3.41 (2H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.92 (3H, s), 2.69 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.81 (2H, tt,  $J=7.0\text{ Hz}$ ,  $J=7.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 698, 700 ( $M-1$ ), 702 ( $M+1$ )

化合物 762 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチル-フェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 762 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) : 8.44 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.37 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.65–7.77 (3H, m), 7.48 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.40 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.19–7.25 (3H, m), 6.90 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.71 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 6.68 (1H, dd,  $J=7.2\text{Hz}$ ,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 3.81 (3H, s), 3.40 (2H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 2.91 (3H, s), 2.67 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 1.79 (2H, tt,  $J=7.0\text{Hz}$ ,  $J=7.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 626 ( $M-1$ ), 630 ( $M+1$ )

化合物 763 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-{[3-(メチルフェニル-アミノ)-プロピルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 763 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) : 8.44 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.40 (1H, s), 7.97 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.71 (1H, s), 7.18–7.54 (8H, m), 6.94–7.00 (1H, m), 6.71 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 6.68 (1H, dd,  $J=7.2\text{Hz}$ ,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 3.84 (3H, s), 3.82 (2H, s), 3.40 (2H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 2.91 (3H, s), 2.67 (2H, t,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 1.80 (2H, tt,  $J=7.0\text{Hz}$ ,  $J=7.0\text{Hz}$ ),

質量分析 (ESI-MS) 626 ( $M-1$ ), 630 ( $M+1$ )

化合物 764 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 764 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) : 8.37–8.45 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.72 (1H, s), 7.60 (1

H, s), 7.42–7.50 (4H, m), 7.07–7.20 (2H, m), 3.88 (2H, s), 2.83 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 2.73 (2H, t,  $J=6.6$  Hz), 2.51 (2H, q,  $J=7.3$  Hz), 2.26 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.24 (3H, t,  $J=7.4$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 565 ( $M-1$ )

**化合物 765** N-[4-ブromo-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 765 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz): 8.39–8.45 (2H, m), 7.84–8.02 (2H, m), 7.68 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.42–7.50 (3H, m), 7.15–7.25 (3H, m), 3.88 (2H, s), 2.83 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.73 (2H, t,  $J=6.3$  Hz), 2.52 (2H, q,  $J=7.4$  Hz), 2.36 (3H, s), 1.25 (3H, t,  $J=7.4$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 551 ( $M-1$ )

**化合物 766** N-[4-ブromo-2-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 766 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz): 8.44 (1H, s), 8.37 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.99 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.68 (2H, s), 7.54 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.42–7.50 (3H, m), 7.29 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.22 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 3.87 (2H, s), 2.81 (2H, t,  $J=6.5$  Hz), 2.72 (2H, t,  $J=6.2$  Hz), 2.53 (2H, q,  $J=7.4$  Hz), 2.37 (3H, s), 1.26 (3H, t,  $J=7.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 551 ( $M-1$ )

化合物 7 6 7 N- [4-ブromo-2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [ (2-エチルスルファニル-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 6 7 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.46 (1H, s), 8.33 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.80 (2H, bs), 7.65 (1H, s), 7.45 (3H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.10 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 3.87 (2H, s), 2.82 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.72 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 2.53 (2H, q,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.26 (3H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 557 (M-1)

化合物 7 6 8 N- [4-ブromo-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [ (2-エチルスルファニル-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 6 8 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.46 (1H, bs), 8.34 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.99 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.66 (1H, bs), 7.34-7.60 (6H, m), 7.11 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 3.89 (2H, s), 2.83 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 2.73 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.54 (2H, q,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.26 (3H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 555 (M-1)

化合物 7 6 9 N- [4-ブromo-2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -4- [ (2-エチルスルファニル-エチルアミノ) -メチル] -ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 7 6 9 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.53 (1H, s), 8.27

(1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, s), 7.99 (3H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.63 (1H, bs), 7.57 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.40–7.50 (3H, m), 3.90 (2H, s), 2.84 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.73 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 2.54 (2H, q,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.27 (3H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 643 ( $M-1$ )

化合物 770 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドロジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 770 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.37–8.45 (2H, m), 7.98 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.68–7.74 (3H, m), 7.47 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.42 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 6.90 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 3.81 (3H, s), 2.81 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 2.72 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.52 (2H, q,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.25 (3H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 569 ( $M-1$ )

化合物 771 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドロジノカルボニル)-フェニル]-4-[(2-エチルスルファニル-エチルアミノ)-メチル]-ベンズアミド

実施例 8 に記載の方法に従って、表題の化合物 771 を製造した。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.45 (1H, s), 8.39 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.97 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.73 (1H, bs), 7.40–7.50 (3H, m), 7.34 (1H, s), 7.26–7.30 (2H, m), 6.90–7.00 (1H, m), 3.85 (2H, s), 3.83 (3H, s), 2.81 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 2.71 (2H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 2.53 (2H, q,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.25 (3H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ )



質量分析 (ESI-MS) 567 (M-1)

化合物 772 N-[4-ブromo-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 772 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.59 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.64 (2H, bs), 6.62 (2H, m), 7.18 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.59 (7H, m), 8.00 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 8.18 (1H, m), 8.31 (1H, s), 8.56 (1H, m), 10.08 (1H, bs), 11.68 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 623 (M-1)

化合物 773 N-[4-ブromo-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 773 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.39 (3H, s), 2.59 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.64 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.23 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.59 (7H, m), 8.00 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.18 (1H, m), 8.32 (1H, s), 8.60 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 9.90 (1H, bs), 11.70 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 611 (M-1)

化合物 774 N-[4-ブromo-2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 774 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.59 (4H, bs), 3.59 (4H, bs), 3.65 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.1

2 (2H, m), 7, 64 (7H, m), 8.00 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.18 (1H, m), 8.37 (1H, bs), 8.60 (1H, m), 10.20 (1H, bs), 11.70 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 613 (M-1)

化合物 775 N-[4-ブromo-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 775 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  2.59 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.65 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.14 (1H, m), 7.50 (8H, m), 8.00 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.18 (1H, m), 8.40 (1H, s), 8.55 (1H, bs), 10.30 (1H, bs), 11.60 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 613 (M-1)

化合物 776 N-[4-ブromo-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 776 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  2.60 (4H, bs), 3.58 (4H, bs), 3.65 (2H, bs), 6.63 (2H, m), 7.54 (6H, m), 8.02 (4H, m), 8.18 (1H, m), 8.47 (2H, bs), 10.45 (1H, bs), 11.50 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 697 (M-1)

化合物 777 N-[4-ブromo-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 777 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  2.59 (4H, bs), 3.61 (6H, m), 3.84 (3H, s), 6.62 (2H, m), 6.93

(2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.49 (4H, m), 7.72 (3H, m), 7.80 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.18 (1H, m), 8.31 (1H, bs), 8.58 (1H, m), 9.99 (1H, bs), 11.69 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 625 ( $M-1$ )

化合物 778 N-[4-ブromo-2-(3-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-4-(4-ピリジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 778 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  2.59 (4H, bs), 3.59 (6H, m), 3.86 (3H, s), 6.63 (2H, m), 6.98 (1H, m), 7.32 (3H, m), 7.54 (4H, m), 7.72 (1H, m), 8.00 (2H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 8.18 (1H, m), 8.34 (1H, bs), 8.60 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 625 ( $M-1$ )

化合物 779 3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 779 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.10 (6H, m), 2.51 (4H, m), 3.88 (4H, m), 7.03 (1H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 7.53 (2H, m), 7.68 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.06 (2H, m), 8.32 (1H, bs), 8.39 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 595 ( $M-1$ )

化合物 780 3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 780 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.10 (6H, m), 2.51 (4H, m), 3.88 (7H, m), 7.00 (3H, m), 7.53 (2H, m), 7.68 (1H, m), 7.80 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.93 (1H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, m), 8.31 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 523 ( $M-1$ )

化合物 781 2- { 3- [ 3- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチルーチオフェン-2-イルカルバモイル ] - ベンジルスルファニル } - エタンスルフォニック アシッド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 781 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.30 (6H, m), 2.47 (3H, s), 2.79 (2H, m), 2.98 (2H, m), 3.85 (2H, bs), 6.71 (1H, m), 7.18 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.20-8.00 (6H, m), 8.23 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 544 ( $M-1$ )

化合物 782 2- { 3- [ 4-メチルー 3- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - チオフェン-2-イルカルバモイル ] - ベンジルスルファニル } - エタンスルフォニック アシッド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 782 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.39 (3H, s), 2.47 (3H, s), 2.79 (2H, m), 2.99 (2H, m), 3.84 (2H, s), 6.72 (1H, m), 7.20-7.94 (8H, m), 8.26 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 530 ( $M-1$ )

化合物 783 2- { 3- [ 3- (4-フルオローベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-メチルーチオフェン-2-イルカルバモイル ] - ベンジルスルファニル } - エタンスルフォニック アシッド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 783 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.47 (3H, bs), 2.

8.0 (2H, m), 2.99 (2H, m), 3.84 (2H, bs), 6.72 (1H, m), 7.14 (2H, m), 7.49 (1H, m), 7.61 (1H, m), 7.92 (4H, m), 8.29 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 534 (M-1)

化合物 784 2- {3- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 784 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.47 (3H, bs), 2.79 (2H, m), 2.98 (2H, m), 3.84 (2H, bs), 6.70 (1H, m), 7.40-8.02 (6H, m), 8.31 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 618 (M-1)

化合物 785 2- {3- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -エタンスルフォニック アシッド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 785 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.47 (3H, bs), 2.81 (2H, m), 2.98 (2H, m), 3.84 (5H, m), 6.71 (1H, m), 6.97 (2H, m), 7.44-7.98 (6H, m), 8.24 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 546 (M-1)

化合物 786 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 786 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.30 (6H, m), 2.50 (3H, s), 2.69 (4H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 3.63 (4H, t,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, s), 6.69 (1H, m), 7.19 (1H, m), 7.51 (2H, m), 7.65 (2H, m), 7.87 (1H,

m), 7.98 (1H, s), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 507 (M-1)

化合物 787 3- { [ビス- (2-ヒドロキシーエチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 787 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.38 (3H, s), 2.57 (3H, s), 2.78 (4H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3.74 (4H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3.84 (2H, s), 6.50 (1H, s), 7.19 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, m), 7.70 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, m), 8.08 (1H, s), 8.25 (1H, s), 9.16 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 493 (M-1)

化合物 788 3- { [ビス- (2-ヒドロキシーエチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 788 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.54 (3H, s), 2.79 (4H, t,  $J=5.2\text{ Hz}$ ), 3.74 (4H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3.83 (2H, s), 6.48 (1H, s), 7.04 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.80 (2H, m), 8.00 (1H, m), 8.13 (1H, s), 8.26 (1H, s), 9.28 (1H, s), 13.16 (1H, b s)

質量分析 (ESI-MS) 497 (M-1)

化合物 789 3- { [ビス- (2-ヒドロキシーエチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 789 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.56 (3H, s), 2.7

9 (4H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 3.75 (4H, m), 3.84 (2H, s), 6.47 (1H, s), 7.04 (1H, m), 7.17–7.70 (5H, m), 8.01 (1H, m), 8.16 (1H, s), 8.29 (1H, s), 9.35 (1H, s), 13.20 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 497 (M-1)

化合物 790 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 790 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.50 (3H, s), 2.72 (4H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.65 (4H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.84 (2H, s), 6.71 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, m), 7.67 (2H, m), 7.85 (1H, m), 8.00 (2H, m), 8.33 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 581 (M-1)

化合物 791 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 791 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.55 (3H, s), 2.79 (4H, t,  $J=5.2\text{ Hz}$ ), 3.74 (4H, m), 3.85 (5H, m), 6.51 (1H, s), 6.92 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.67 (1H, m), 7.77 (1H, m), 8.01 (1H, m), 8.05 (1H, s), 8.26 (1H, s), 9.09 (1H, s), 13.27 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 509 (M-1)

化合物 792 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 792 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.13 (3H, d,  $J=2.2$  Hz), 1.15 (3H, d,  $J=2.2$  Hz), 2.26 (6H, m), 2.51 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.63 (2H, m), 3.65–4.05 (4H, m), 7.12 (1H, m), 7.30 (1H, m), 7.40–7.51 (4H, m), 7.67 (1H, m), 7.86 (2H, m), 8.03 (1H, m), 8.18 (1H, s), 8.25 (1H, d,  $J=5.6$  Hz), 9.44 (1H, s), 13.13 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 571 ( $M-1$ )

化合物 793 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 793 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.13 (6H, m), 2.39 (3H, s), 2.51 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.64 (2H, m), 3.65–4.05 (4H, m), 7.19 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.32 (1H, m), 7.42–7.50 (3H, m), 7.75 (2H, m), 7.86 (2H, m), 8.04 (1H, m), 8.19 (1H, m), 8.28 (1H, d,  $J=6.1$  Hz), 9.40 (1H, s), 13.14 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 557 ( $M-1$ )

化合物 794 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 794 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.13 (6H, m), 2.51 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.65 (2H, m), 3.63–4.08 (4H, m), 7.07 (2H, m), 7.29 (1H, m), 7.36–7.50 (3H, m), 7.85 (4H, m), 8.03 (1H, m), 8.26



(2H, m), 9.50 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 13.13 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 561 (M-1)

化合物 795 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 795 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.15 (6H, m), 2.53 (2H, m), 2.67 (2H, m), 3.61-4.14 (4H, m), 7.01 (1H, m), 7.11-7.30 (3H, m), 7.45 (3H, m), 7.62-7.90 (3H, m), 7.99 (1H, m), 8.23 (1H, d,  $J=12.7$  Hz), 8.35 (1H, d,  $J=6.1$  Hz), 9.82 (1H, d,  $J=13.9$  Hz), 13.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 561 (M-1)

化合物 796 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 796 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.14 (3H, d,  $J=6.1$  Hz), 1.17 (3H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.50-2.80 (4H, m), 3.63-4.16 (4H, m), 7.06 (2H, m), 7.30 (1H, m), 7.44 (2H, m), 7.70 (1H, m), 7.80-8.07 (4H, m), 8.16 (1H, s), 8.53 (1H, s), 10.08 (1H, d,  $J=6.1$  Hz), 13.10 (1H, d,  $J=1.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 645 (M-1)

化合物 797 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 797 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.13 (6H, m), 2.51 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 2.63 (2H, m), 3.64–4.06 (7H, m), 6.90 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.31 (1H, m), 7.48 (3H, m), 7.83 (4H, m), 8.03 (1H, m), 8.18 (1H, m), 8.28 (1H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 9.38 (1H, s), 13.16 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 573 ( $M-1$ )

化合物 798 N-[3-(3,4-ジメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)–ベンゾ[b]チオフェン–2–イル]–3-(4-ヒドロキシメチルーピペリジン–1–イルメチル)–ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 798 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.35 (2H, m), 1.51 (1H, m), 1.72 (2H, m), 2.05 (2H, m), 2.29 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.93 (2H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, s), 7.18 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.32 (1H, m), 7.47 (3H, m), 7.61 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.66 (1H, s), 7.87 (2H, m), 7.97 (1H, m), 8.04 (1H, m), 8.17 (1H, m), 9.34 (1H, bs), 12.85 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 553 ( $M-1$ )

化合物 799 3-(4-ヒドロキシメチルーピペリジン–1–イルメチル)–N-[3-(4-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)–ベンゾ[b]チオフェン–2–イル]–ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 799 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.42 (2H, m), 1.52 (1H, m), 1.73 (2H, m), 2.12 (2H, m), 2.38 (3H, s), 3.00 (2H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.70 (2H, s), 7.23 (2H, m), 7.32 (1H, m), 7.45 (2H, m), 7.64 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.71 (2H, m),

8. 86 (2H, m), 7. 97 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 8. 03 (1H, m), 8. 21 (1H, s), 9. 40 (1H, bs), 12. 84 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 539 ( $M-1$ )

化合物 800 N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 800 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1. 40–1. 60 (3H, m), 1. 73 (2H, m), 2. 17 (2H, m), 3. 05 (2H, m), 3. 50 (2H, d,  $J=5.9$  Hz), 3. 75 (2H, s), 7. 04 (1H, m), 7. 11 (2H, m), 7. 28 (1H, m), 7. 37–7. 50 (2H, m), 7. 64 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 83 (2H, m), 7. 94 (1H, m), 8. 01 (1H, s), 8. 07 (1H, m), 8. 26 (1H, s), 9. 50 (1H, bs), 12. 73 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 543 ( $M-1$ )

化合物 801 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ベンゾ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 801 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1. 40 (2H, m), 1. 53 (1H, m), 1. 72 (2H, m), 2. 09 (2H, m), 2. 96 (2H, m), 3. 50 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 3. 66 (2H, s), 7. 13 (1H, m), 7. 31 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7. 35–7. 66 (6H, m), 7. 85 (2H, m), 7. 94 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8. 02 (1H, s), 8. 23 (1H, s), 9. 52 (1H, bs), 12. 73 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 543 ( $M-1$ )

化合物 802 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデ

ン-ヒドラジノカルボニル) -ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -3- (4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル) -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 802 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.40 (2H, m), 1.15 (1H, m), 1.72 (2H, m), 2.09 (2H, m), 2.95 (2H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.65 (2H, s), 7.27 (1H, m), 7.40 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.47 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.82 (2H, m), 7.90 (1H, m), 7.95 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.06 (1H, s), 8.35 (1H, s), 9.69 (1H, bs), 12.63 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 627 (M-1)

化合物 803 3- (4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル) -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 803 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.39 (2H, m), 1.52 (1H, m), 1.71 (2H, m), 2.07 (2H, m), 2.95 (2H, m), 3.49 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.64 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.93 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.29 (1H, m), 7.38-7.48 (2H, m), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.75 (1H, m), 7.84 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.95 (2H, m), 8.01 (1H, s), 8.20 (1H, s), 9.42 (1H, bs), 12.81 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 555 (M-1)

#### 実施例 A

化合物 804 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)

ー5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

エチル-2-アミノシクロペンタ (B) チオフェン-3-カルボキシレート (化合物A) (1.0 g) を、無水塩化メチレン (20.0 ml) に溶解させた。続いて、0℃にてピリジン (760  $\mu$ l)、3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (880  $\mu$ l) をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、有用中間体である、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-3-カルボキシル酸 エチルエステルを製造した (800 mg、粗収率100%)。

上記反応で得られた、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-3-カルボキシル酸 エチルエステル (800 mg) を、無水塩化メチレン (10.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (420  $\mu$ l)、ジイソプロパノールアミン (化合物B') (585 mg) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-3-カルボキシル酸 エチルエステルを製造した (616 mg、収率61%)。

上記反応で得られた、2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-3-カルボキシル酸 エチルエステル (616 mg) を、エタノール (10.0 ml) に溶解させ、ヒドラジン-水和物 (700  $\mu$ l) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウ

ムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、ヒドラジン化合物3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- (3-ヒドラジノカルボニル-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル) -ベンズアミドを製造した (372 mg、収率60%)。

上記反応で得られた、3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- (3-ヒドラジノカルボニル-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル) ベンズアミド (60.0 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物C) (70.0  $\mu$ l) を添加し、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物804を製造した (70.0 mg、収率10.0%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.13 (6H, m), 2.28 (6H, m), 2.46-2.66 (6H, m), 2.92 (2H, m), 3.05 (2H, m), 3.58-4.05 (4H, m), 7.12 (1H, m), 7.46 (3H, m), 7.64 (1H, d,  $J=5.1$  Hz), 8.00 (2H, m), 8.22 (1H, m), 8.95 (1H, s), 13.16 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 561 (M-1)

化合物805 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物805を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.13 (6H, m), 2.36 (3H, m), 2.49 (4H, m), 2.62 (2H, m), 2.89 (2H, m), 3.02 (2H, m), 3.60-4.06 (4H, m), 7.13

(2H, m), 7.44 (2H, m), 7.67 (2H, dd,  $J=8.2\text{ Hz}$ ,  $J=2.6\text{ Hz}$ ), 8.01 (2H, m), 8.23 (1H, m), 8.97 (1H, s), 13.16 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

化合物 806 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 806を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.14 (6H, m), 2.50 (4H, m), 2.65 (2H, m), 2.89 (2H, m), 3.03 (2H, m), 3.68-4.10 (4H, m), 7.02 (1H, m), 7.27 (1H, m), 7.45 (3H, m), 7.67 (1H, m), 8.03 (1H, m), 8.15 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 8.29 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 9.11 (1H, s), 13.17 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

化合物 807 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 807を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.12 (6H, m), 2.49 (4H, m), 2.64 (2H, m), 2.88 (2H, m), 3.02 (2H, m), 3.02-4.06 (4H, m), 7.01 (2H, m), 7.45 (2H, m), 7.79 (2H, m), 8.02 (1H, m), 8.10 (1H, s), 8.27 (1H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 9.04 (1H, s), 13.18 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

化合物 808 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル}

ル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物808を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 12 (6H, m), 2. 25-3. 07 (10H, m), 3. 58-4. 10 (4H, m), 7. 31 (1H, m), 7. 46 (2H, m), 7. 86 (1H, m), 7. 98 (1H, s), 8. 05 (1H, m), 8. 33 (2H, m), 9. 28 (1H, m), 13. 18 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 635 (M-1)

化合物809 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物809を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 13 (6H, m), 2. 35-2. 65 (6H, m), 2. 91 (2H, m), 3. 04 (2H, m), 3. 59-4. 04 (7H, m), 6. 88 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7. 46 (2H, m), 7. 76 (2H, dd,  $J=9.1\text{ Hz}$ ,  $J=2.1\text{ Hz}$ ), 8. 02 (2H, m), 8. 24 (1H, m), 8. 92 (1H, s), 13. 20 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

### 実施例B

化合物810 3- [ (2-ジエチルアミノ-エチルアミノ) -メチル] -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

エチル-2-アミノシクロペンタ (B) チオフェン-3-カルボキシレート (化合物A) (1. 0 g) を、無水塩化メチレン (20. 0 ml) に溶解させた。続いて、0°Cにてピリジン (760  $\mu$ l)、3- (クロロメチル) ベンゾイルク



ロライド（化合物B）（ $880\mu\text{l}$ ）をそれぞれ加え、 $0^{\circ}\text{C}$ にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、有用中間体である、2-（3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ）-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-3-カルボキリックアシッド エチルエステルを製造した（ $800\text{mg}$ 、粗収率100%）。

上記反応で得られた、2-（3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ）-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-3-カルボキリックアシッド エチルエステル（ $800\text{mg}$ ）を、無水塩化メチレン（ $10.0\text{ml}$ ）に溶解させ、室温にてトリエチルアミン（ $420\mu\text{l}$ ）、N, N-ジエチルエチレンジアミン（化合物B'）（ $510\text{mg}$ ）を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である2-〔3-〔（2-ジエチルアミノ-エチルアミノ）-メチル]-ベンゾイルアミノ〕-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステルを製造した（ $671\text{mg}$ 、収率68%）。

上記反応で得られた、2-〔3-〔（2-ジエチルアミノ-エチルアミノ）-メチル]-ベンゾイルアミノ〕-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル（ $671\text{mg}$ ）を、エタノール（ $10.0\text{ml}$ ）に溶解させ、ヒドラジン-水和物（ $700\mu\text{l}$ ）を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、ヒドラジン化合物3-〔（2-ジエチルアミノ-エチルアミノ）-メチル-N-（3-ヒドラジノカルボニル-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-2-イル）-ベンズアミド〕を製造した（ $438\text{mg}$ 、収率65%）。

上記反応で得られた、ヒドラジン化合物 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル-N-(3-ヒドラジノカルボニル-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-2-イル)-ベンズアミド (50 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて 3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物 C) (70.0  $\mu$ l) を添加し、室温で 15 時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物 810 を製造した (43.0 mg、収率 66%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.28 (6H, s), 2.47–2.67 (8H, m), 2.74 (2H, m), 2.90 (2H, m), 3.05 (2H, m), 3.90 (2H, s), 7.14 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.43 (2H, m), 7.57 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.61 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.99 (2H, s), 8.96 (1H, bs), 12.95 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 544 (M-1)

**化合物 811** 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5, 6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 811 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.06 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.38 (3H, s), 2.51–2.80 (10H, m), 2.93 (2H, m), 3.06 (2H, m), 3.91 (2H, s), 7.21 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.45 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.67 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.95 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.00 (1H, s), 8.04 (1H, s), 8.98 (1H, bs), 12.95 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 530 (M-1)

**化合物 812** 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5, 6-ジヒ

ドロー4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド  
 実施例Bとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物812を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.07 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.51 (2H, m), 2.66 (4H, m), 2.73 (2H, m), 2.78 (2H, m), 2.89 (2H, m), 3.04 (2H, m), 3.90 (2H, s), 7.09 (1H, m), 7.35 (1H, m), 7.40-7.60 (4H, m), 7.92 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.98 (1H, s), 8.09 (1H, s), 9.09 (1H, bs), 12.83 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 534 ( $M-1$ )

化合物813 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロー4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド  
 実施例Bとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物813を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.49-2.70 (8H, m), 2.75 (2H, m), 2.91 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.05 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 3.90 (2H, s), 7.09 (2H, dd,  $J=8.6\text{ Hz}$ ,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.44 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.76 (2H, m), 7.93 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.99 (1H, s), 8.08 (1H, s), 9.02 (1H, bs), 12.88 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 534 ( $M-1$ )

化合物814 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロー4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル] -3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル] -ベンズアミド

実施例Bとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物814を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.$

2 Hz), 2.46–2.65 (8H, m), 2.71 (2H, m), 2.88 (2H, t,  $J=7.1$  Hz), 3.03 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 3.88 (2H, s), 7.45 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.54 (2H, m), 7.90 (2H, m), 7.98 (2H, m), 8.17 (1H, s), 9.13 (1H, bs), 12.78 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 618 (M-1)

化合物 815 3-[(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-メチル]-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 815 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.45–2.65 (8H, m), 2.71 (2H, m), 2.89 (2H, t,  $J=7.2$  Hz), 3.03 (2H, t,  $J=7.1$  Hz), 3.83 (3H, s), 3.89 (2H, s), 6.89 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.44 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.56 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.69 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.93 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.99 (2H, m), 8.93 (1H, bs), 12.94 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 546 (M-1)

化合物 816 N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 816 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  1.38 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.73 (2H, d,  $J=12.0$  Hz), 2.07 (2H, m), 2.30 (6H, s), 2.56 (2H, m), 2.94 (4H, m), 3.07 (2H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 3.65 (2H, s), 7.17 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.46 (2H, m), 7.

6.0 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.64 (1H, s), 7.97 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.01 (2H, m), 8.96 (1H, s), 12.97 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 543 (M-1)

化合物 817 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-2-イル]-ベンズアミド  
実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 817 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.39 (2H, m), 1.52 (1H, m), 1.72 (2H, d,  $J=11.5$  Hz), 2.11 (2H, m), 2.39 (3H, s), 2.55 (2H, m), 2.90-3.02 (4H, m), 3.07 (2H, t,  $J=7.1$  Hz), 3.49 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 3.69 (2H, s), 7.21 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.45 (1H, dd,  $J=7.5$  Hz,  $J=7.5$  Hz), 7.61 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.67 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.94-8.02 (2H, m), 8.05 (1H, s), 8.97 (1H, s), 12.95 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 529 (M-1)

化合物 818 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ[b]チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド  
実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 818 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.35 (2H, m), 1.45-1.75 (3H, m), 2.03 (2H, m), 2.57 (2H, m), 2.94 (4H, m), 3.08 (2H, d,  $J=7.1$  Hz), 3.50 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 3.60 (2H, s), 7.12 (2H, dd,  $J=8.6$  Hz,  $J=8.6$  Hz), 7.45 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.80 (2H, m), 7.95 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.09 (1H,

s), 8.99 (1H, s), 12.90 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 (M-1)

化合物 819 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド  
実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 819 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.36-1.62 (3H, m), 1.74 (2H, m), 2.14 (2H, m), 2.56 (2H, m), 2.90-3.14 (6H, m), 3.50 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.72 (2H, s), 7.11 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.44-7.59 (3H, m), 7.62 (1H, m), 7.90-8.03 (2H, m), 8.10 (1H, s), 9.06 (1H, s), 12.88 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 (M-1)

化合物 820 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル]-3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 820 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.30-1.77 (5H, m), 2.03 (2H, m), 2.58 (2H, m), 2.93 (4H, m), 3.08 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 3.50 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.60 (2H, s), 7.46 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.58 (2H, m), 7.90-8.06 (4H, m), 8.19 (1H, s), 9.09 (1H, s), 12.81 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 617 (M-1)

化合物 821 3-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5,6-ジヒドロ-4H-シクロペンタ [b] チオフェン-2-イル]-ベンズアミド  
実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 821 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.34 (2H, m), 1.50 (1H, m), 1.70 (2H, m), 2.02 (2H, m), 2.54 (2H, m), 2.91 (4H, m), 3.59 (2H, m), 3.49 (2H, d,  $J=6.3\text{Hz}$ ), 3.58 (2H, s), 3.85 (3H, s), 6.92 (2H, m), 7.44 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.72 (2H, m), 7.94 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 8.01 (2H, m), 8.92 (1H, s), 12.96 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 545 ( $M-1$ )

化合物 822 3-ジメチルアミノメチル-N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物822を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.26 (6H, s), 2.29 (6H, s), 2.58 (3H, s), 3.53 (2H, s), 6.51 (1H, d,  $J=1.0\text{Hz}$ ), 7.17 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.46 (2H, m), 7.57 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.64 (1H, s), 7.95 (2H, m), 8.08 (1H, s), 9.11 (1H, s), 12.93 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 447 ( $M-1$ )

化合物 823 3-ジメチルアミノメチル-N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物823を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.26 (6H, s), 2.39 (3H, s), 2.58 (3H, s), 3.53 (2H, s), 6.52 (1H, d,  $J=1.0\text{Hz}$ ), 7.23 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.46 (1H, dd,  $J=8.3\text{Hz}$ ,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.69 (2H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.95 (2H, m),

8. 12 (1H, s), 9. 12 (1H, s), 12. 91 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 433 (M-1)

化合物 824 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-ジメチルアミノメチル-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物824を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz):  $\delta$  2. 26 (6H, s), 2. 52 (3H, s), 3. 53 (2H, s), 6. 49 (1H, s), 7. 47 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7. 57 (2H, m), 7. 94 (3H, m), 8. 04 (1H, m), 8. 27 (1H, s), 9. 36 (1H, bs), 12. 66 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 521 (M-1)

化合物 825 3-ジメチルアミノメチル-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物825を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz):  $\delta$  2. 26 (6H, s), 2. 57 (3H, s), 3. 53 (2H, s), 3. 85 (3H, s), 6. 51 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 6. 93 (2H, m), 7. 46 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7. 57 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7. 74 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7. 95 (2H, m), 8. 09 (1H, s), 9. 09 (1H, s), 12. 93 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 449 (M-1)

化合物 826 N-[3-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(4-ピリミジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物826を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz):  $\delta$  2. 29 (6H, s), 2. 53 (4H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 2. 59 (3H, s), 3. 63 (2H,



s), 3.84 (4H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 6.45 (1H, dd,  $J=4.6\text{ Hz}$ ,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 6.54 (1H, s), 7.17 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.47 (2H, m), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.64 (1H, s), 7.96 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s), 8.07 (1H, s), 8.28 (2H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 9.07 (1H, s), 12.99 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 566 ( $M-1$ )

化合物 827 N-[4-メチル-3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-3-(4-ピリミジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 827 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{ MHz}$ ):  $\delta$  2.39 (3H, s), 2.53 (4H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 2.59 (3H, s), 3.64 (2H, s), 3.85 (4H, t,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 6.46 (1H, dd,  $J=4.7\text{ Hz}$ ,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 6.53 (1H, s), 7.21 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.47 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.68 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.96 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s), 8.11 (1H, s), 8.29 (2H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 9.09 (1H, s), 12.97 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 552 ( $M-1$ )

化合物 828 N-[3-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(4-ピリミジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 828 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{ MHz}$ ):  $\delta$  2.54 (4H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 2.59 (3H, s), 3.64 (2H, s), 3.85 (4H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 6.46 (1H, dd,  $J=4.9\text{ Hz}$ ,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 6.54 (1H, s), 7.10 (2H, m), 7.46 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.64 (1H, s), 7.96 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s), 8.11 (1H, s), 8.29 (2H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 9.09 (1H, s), 12.97 (1H, bs)

6 Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.79 (2H, m), 7.95 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.05 (1H, s), 8.15 (1H, s), 8.29 (2H, d,  $J=4.9$  Hz), 9.12 (1H, s), 12.92 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 556 ( $M-1$ )

化合物 829 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(4-ピリミジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 829 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  2.53 (4H, t,  $J=5.0$  Hz), 2.59 (3H, s), 3.64 (2H, s), 3.85 (4H, t,  $J=5.0$  Hz), 6.46 (1H, dd,  $J=4.7$  Hz,  $J=4.7$  Hz), 6.55 (1H, s), 7.12 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.46-7.64 (4H, m), 7.95 (1H, m), 8.05 (1H, m), 8.17 (1H, s), 8.28 (2H, d,  $J=4.6$  Hz), 9.17 (1H, s), 12.87 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 556 ( $M-1$ )

化合物 830 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-3-(4-ピリミジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 830 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  2.53 (4H, t,  $J=5.0$  Hz), 2.59 (3H, s), 3.65 (2H, s), 3.85 (4H, t,  $J=5.0$  Hz), 6.46 (1H, dd,  $J=4.8$  Hz,  $J=4.8$  Hz), 6.55 (1H, s), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.55 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.61 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.96 (2H, m), 8.05 (2H, m), 8.26 (1H, s), 8.28 (2H, d,  $J=4.6$  Hz), 9.21 (1H, s), 12.84 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 640 (M-1)

化合物 831 N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(4-ピリミジン-2-イル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 831 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz) :  $\delta$  2.53 (4H, t,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 2.60 (3H, s), 3.64 (2H, s), 3.84 (7H, m), 6.45 (1H, d,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 6.55 (1H, s), 6.93 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.47 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.61 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.74 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s), 8.08 (1H, s), 8.29 (2H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 9.02 (1H, s), 13.04 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

化合物 832 N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(1,4-ジオキサ-8-アザースピロ[4,5]デク-8-イルメチル)-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 832 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400MHz) :  $\delta$  1.76 (4H, m), 2.31 (6H, s), 2.55 (4H, m), 2.62 (3H, s), 3.62 (2H, s), 3.94 (4H, s), 6.55 (1H, s), 7.26 (1H, m), 7.47 (2H, m), 7.53 (1H, m), 7.66 (1H, s), 7.95 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.01 (1H, s), 8.07 (1H, s), 9.03 (1H, s), 13.03 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 545 (M-1)

化合物 833 3-(1,4-ジオキサ-8-アザースピロ[4,5]デク-8-イルメチル)-N-[4-メチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 833 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (4H, t,  $J=5.5$  Hz), 2.40 (3H, s), 2.55 (4H, m), 2.60 (3H, s), 3.62 (2H, s), 3.94 (4H, s), 6.54 (1H, s), 7.23 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.45 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.70 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.93 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.11 (1H, s), 9.06 (1H, s), 12.97 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 531 (M-1)

化合物 834 3-(1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4, 5]デク-8-イルメチル)-N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 834 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (4H, t,  $J=5.4$  Hz), 2.56 (4H, m), 2.59 (3H, s), 3.62 (2H, s), 3.94 (4H, s), 6.55 (1H, s), 7.12 (2H, dd,  $J=8.6$  Hz,  $J=8.6$  Hz), 7.45 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.81 (2H, m), 7.93 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.15 (1H, s), 9.10 (1H, s), 12.91 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

化合物 835 3-(1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4, 5]デク-8-イルメチル)-N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例Aとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 835 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (4H, t,  $J=5.4$  Hz), 2.55 (7H, m), 3.62 (2H, s), 3.94 (4H, s), 6.51 (1H, s), 7.11 (1H, m), 7.34-7.60 (5H, m), 7.91 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.

1.8 (1H, s), 9.22 (1H, s), 12.78 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

化合物 836 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-3-(1,4-ジオキサ-8-アザースピロ[4,5]デク-8-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 836 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (4H, t,  $J=5.5$  Hz), 2.57 (7H, m), 3.62 (2H, s), 3.94 (4H, s), 6.53 (1H, d,  $J=1.0$  Hz), 7.46 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.57 (2H, m), 7.91 (1H, m), 7.96-8.02 (2H, m), 8.05 (1H, d,  $J=1.7$  Hz), 8.27 (1H, s), 9.25 (1H, s), 12.76 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 619 (M-1)

化合物 837 3-(1,4-ジオキサ-8-アザースピロ[4,5]デク-8-イルメチル)-N-[3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 837 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz) :  $\delta$  1.76 (4H, m), 2.56 (4H, m), 2.61 (3H, s), 3.63 (2H, s), 3.86 (3H, s), 3.94 (4H, s), 6.55 (1H, s), 6.95 (2H, m), 7.46 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.58 (1H, m), 7.76 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.95 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.08 (1H, s), 9.00 (1H, s), 13.03 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

化合物 838 3-{[ビス-(2-ジエチルアミノ-エチル)-アミノ]-メチル}-N-[3-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例Bとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物838を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.29 (6H, m), 2.43–2.66 (19H, m), 3.73 (2H, s), 6.52 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.17 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.44 (2H, m), 7.62 (2H, m), 7.92 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.01 (1H, s), 8.09 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 617 (M-1)

化合物839 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [4-メチル-3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例Bとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物839を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.38 (3H, s), 2.45–2.65 (19H, m), 3.72 (2H, s), 6.51 (1H, d,  $J=1.2\text{ Hz}$ ), 7.22 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.43 (1H, m), 7.60 (1H, m), 7.68 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.91 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.13 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 603 (M-1)

化合物840 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例Bとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物840を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.43–2.66 (19H, m), 3.72 (2H, s), 6.50 (1H, d,  $J=1.0\text{ Hz}$ ), 7.10 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.44 (1H, m), 7.62 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.79 (2H, m), 7.89 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.18 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 607 (M-1)

化合物 841 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 841 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.44-2.64 (19H, m), 3.73 (2H, s), 6.51 (1H, s), 7.11 (1H, s), 7.34-7.64 (5H, m), 7.90 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.19 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 607 (M-1)

化合物 842 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 842 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.97 (12H, m), 2.42-2.64 (19H, m), 3.72 (2H, m), 6.47 (1H, d,  $J=1.0$  Hz), 7.30-7.68 (4H, m), 7.77-8.05 (3H, m), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 691 (M-1)

化合物 843 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 843 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.45-2.66 (19H, m), 3.72 (2H, s), 3.85 (3H, s), 6.52 (1H, d,  $J=1.0$  Hz), 6.93 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.44 (1H, m), 7.62 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.74 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.92 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 619 (M-1)

化合物 844 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5-ジメチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 844 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.12 (6H, m), 2.26-2.64 (16H, m), 3.62-4.05 (4H, m), 7.13 (1H, m), 7.40-7.56 (3H, m), 7.65 (1H, m), 7.99 (1H, m), 8.04 (1H, s), 8.19 (1H, s), 9.10 (1H, s), 13.02 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 549 (M-1)

化合物 845 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4,5-ジメチル-3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 845 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, m), 2.28-2.64 (13H, m), 3.60-4.04 (4H, m), 7.21 (2H, m), 7.43 (2H, m), 7.73 (2H, m), 7.99 (1H, m), 8.07 (1H, s), 8.21 (1H, s), 9.09 (1H, bs), 13.01 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 535 (M-1)

化合物 846 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[3-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5-ジメチルチオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 846 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, m), 2.24-2.52 (8H, m), 2.63 (2H, m), 3.60-4.06 (4H, m), 7.04 (2H, m), 7.43 (2H, m), 7.83 (2H, m), 7.99 (1H, m), 8.13 (1H, s), 8.24 (1H, m), 9.2



4 (1H, s), 12.98 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 539 (M-1)

化合物 847 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5-ジメチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 847 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, m), 2.19 (3H, m), 2.28 (3H, m), 2.52 (2H, m), 2.67 (2H, m), 3.60-4.10 (4H, m), 7.33 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.38-7.50 (2H, m), 7.86 (1H, m), 7.98-8.10 (2H, m), 8.28 (1H, s), 8.36 (1H, s), 9.57 (1H, s), 13.03 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 623 (M-1)

化合物 848 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5-ジメチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 848 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.11 (6H, m), 2.24-2.64 (10H, m), 3.60-4.04 (7H, m), 6.91 (2H, m), 7.43 (2H, m), 7.79 (2H, m), 8.02 (2H, m), 8.23 (1H, s), 9.04 (1H, s), 13.02 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 551 (M-1)

化合物 849 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 849 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.91 (4H, m), 2.48 (8H, m), 2.58 (8H, m), 2.76 (2H, m), 2.87 (2H, m), 3.73 (2H, s), 7.44 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.57 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.62 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.90 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.97 (1H, dd,  $J=8.3$  Hz,  $J=2.0$  Hz), 8.00 (1H, s), 8.04 (1H, d,  $J=1.7$  Hz), 8.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 731 (M-1)

化合物 850 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 850 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.2$  Hz), 1.92 (4H, m), 2.49 (8H, m), 2.58 (8H, m), 2.76 (2H, m), 2.89 (2H, m), 3.72 (2H, s), 3.88 (3H, s), 6.97 (2H, m), 7.27-7.46 (3H, m), 7.61 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.92 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 8.00 (1H, s), 8.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 659 (M-1)

#### 実施例 C

化合物 851 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチル-チオフェン-2-イル] -ベンズアミド ; 塩酸塩

実施例 8 に記載の方法にしたがって得られた化合物 591 : 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチ

ルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド (30 mg) に室温でジエチルエーテル (200  $\mu$ l) を加え、さらに10%-塩酸メタノールを数滴加え、数分間攪拌した後、反応液を桐山ロートを用いてろ過し、結晶をジエチルエーテルにより洗浄し、表題の化合物851を得た (25 mg、収率80%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.14–1.27 (6 H, m), 2.56 (3 H, s), 2.90 (4 H, m), 4.22 (4 H, m), 6.53 (1 H, m), 7.53 (2 H, m), 7.70 (1 H, m), 7.95 (1 H, m), 8.03 (1 H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.07 (1 H, s), 8.20 (1 H, d,  $J=7.3$  Hz), 8.36 (1 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 609 ( $M-1$ )

化合物852 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-メチルーチオフェン-2-イル] -ベンズアミド; 塩酸塩

実施例Cとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物852を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.22 (6 H, d,  $J=6.1$  Hz), 2.53 (3 H, s), 3.30 (4 H, m), 3.85 (3 H, s), 4.20 (4 H, m), 6.73 (1 H, d,  $J=1.0$  Hz), 6.99 (2 H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.60–7.85 (4 H, m), 8.00–8.29 (3 H, m)

質量分析 (ESI-MS) 538 ( $M-1$ )

#### 実施例D

化合物853 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-フルオロフェニル] -ベンズアミド; 塩酸塩

実施例Aに記載の方法にしたがって得られた化合物857: 3- { [ビス-(2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-フルオロフェニル] -ベンズアミド (30 mg) に室温でジエチルエーテル (200  $\mu$ l) を加え、さらに10%-塩酸メタノールを数滴加え、数分間攪拌した後、

反応液を桐山ロートを用いてろ過し、結晶をジエチルエーテルにより洗浄し、表題の化合物 853 を得た (25 mg、収率 80%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.15–1.32 (6H, m), 3.00–3.40 (4H, m), 4.10–4.86 (4H, m), 7.44 (1H, m), 7.68–7.85 (4H, m), 8.03 (1H, d,  $J = 7.8\text{ Hz}$ ), 8.14 (2H, m), 8.36 (1H, m), 8.41 (1H, s), 8.62 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 608 ( $M-1$ )

化合物 854 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-フルオロ-2- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド; 塩酸塩

実施例 D とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 854 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.18 (6H, m), 3.30 (4H, m), 3.85 (3H, s), 4.00–4.30 (4H, m), 6.98 (2H, d,  $J = 8.5\text{ Hz}$ ), 7.35 (1H, m), 7.65–7.83 (5H, m), 8.00–8.17 (2H, m), 8.31 (1H, s), 8.70 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 536 ( $M-1$ )

#### 実施例 E

化合物 855 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノエチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド; 塩酸塩

実施例 B に記載の方法にしたがって得られた化合物 849 : 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノエチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド (30 mg) に室温でジエチルエーテル (200  $\mu\text{l}$ ) を加え、さらに 10%-塩酸メタノールを数滴加え、数分間攪拌した後、反応液を桐山ロートを用いてろ

過し、結晶をジエチルエーテルにより洗浄し、表題の化合物 855 を得た (25 mg、収率 80%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.28 (12H, m), 1.91 (4H, m), 2.77 (2H, m), 2.87 (2H, m), 3.04 (4H, m), 3.18 (8H, m), 3.40 (4H, m), 3.92 (2H, s), 7.62 (1H, m), 7.70 (1H, m), 7.77 (1H, m), 7.95 (1H, m), 8.01 (2H, m), 8.32 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 732 (M-1)

**化合物 856** 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノエチル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド; 塩酸塩

実施例 E とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 856 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.29 (12H, m), 1.89 (4H, m), 2.70-2.92 (4H, m), 3.00-3.28 (12H, m), 3.43 (4H, m), 3.87 (3H, s), 3.97 (2H, s), 7.20 (1H, m), 7.30-7.40 (2H, m), 7.52 (1H, m), 7.63 (1H, m), 7.77 (1H, m), 7.98 (1H, m), 8.04 (1H, s), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 660 (M-1)

**化合物 857** 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-フルオロフェニル] -ベンズアミド

実施例 A とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 857 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.08 (6H, m), 2.43-2.60 (4H, m), 3.60-3.95 (4H, m), 7.40 (1H, m), 7.50 (1H, m), 7.60 (1H, m), 7.69 (2H, d,  $J = 7.6\text{ Hz}$ ), 7.85 (1H, m), 8.07 (2H, m), 8.34 (1H, m), 8.38 (1H, s), 8.65 (1H, m),

質量分析 (ESI-MS) 608 (M-1)

# 実施例 F

化合物 858 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピペリジン-1-イル-フェニル] -ベンズアミド

5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド (化合物 A') (5.0 g) をメタノール (150 ml) に溶解させ、0℃にて塩化チオニル (9.5 ml) を加え、加熱還流下で15時間攪拌した。反応終了後、0℃で蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を蒸留水及び飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、有用中間体である、5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した (12.9 g、収率92%)。

上記反応で得られた、5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (2.2 g) をN, N-ジメチルホルムアミド (20 ml) に溶解し、室温でピペリジン (化合物 D) (1.5 g)、炭酸カリウム (1.5 g) を加え、75℃で15時間攪拌した。反応終了後、室温で蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を蒸留水及び飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、有用中間体である、2-ニトロ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.86 g、粗収率69%) を製造した。

上記反応で得られた、2-ニトロ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル (4.8 g) をエタノール (5.0 ml) に溶解し、10%パラジウム-炭素 (500 mg) を加えた後、水素置換し、室温で15時間攪拌した。反応終了後、反応系を窒素置換した後セライトろ過し、濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル (化合物 A) (3.7 g、収率87%) を製造した。

上記反応で得られた、2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイッ

クアシッド メチルエステル (化合物A) (2.1 g) を、無水塩化メチレン (20.0 ml) に溶解させた。続いて、0℃にてピリジン (900  $\mu$ l)、3- (クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (740  $\mu$ l) をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した (1.8 g、収率50%)。

上記反応で得られた、2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル (500 mg) を、無水塩化メチレン (5.0 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (400  $\mu$ l)、N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン (化合物B') (325 mg) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2- (3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンゾイルアミノ) -5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した (612 mg、収率98%)。

上記反応で得られた、2- (3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンゾイルアミノ) -5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル (612 mg) を、エタノール (10.0 ml) に溶解させ、ヒドラジン-水和物 (700  $\mu$ l) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、ヒドラジン化合物、3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- (2-ヒドラジノカルボニル-4-ピペリジン-

1-イル-フェニル)-ベンズアミドを製造した (612 mg、収率100%)。

上記反応で得られたヒドラジン化合物、3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ] -メチル} -N- (2-ヒドラジノカルボニル-4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-ベンズアミド (70 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物C) (40  $\mu$ l) を添加し、70℃で15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物858を製造した (62 mg、収率70%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 1.26 (2H, m), 1.37 (4H, m), 2.26 (9H, m), 2.60 (6H, m), 2.69 (2H, m), 2.84 (4H, m), 3.62 (2H, s), 6.86 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.00 (1H, s), 7.15 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.44 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.53 (2H, m), 7.65 (1H, s), 7.89 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.98 (1H, s), 8.10 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.51 (1H, s), 11.23 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 595 (M-1)

化合物859 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピペリジン-1-イル-フェニル] -ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物859を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 1.29 (2H, m), 1.40 (4H, m), 2.25 (3H, s), 2.37 (3H, s), 2.62 (6H, m), 2.72 (2H, m), 2.87 (4H, m), 3.62 (2H, s), 6.89 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.02 (1H, s), 7.20 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.43 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.53 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.72 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.88 (1H,



d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 8.13 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.51 (1H, s), 11.23 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 581 (M-1)

化合物 860 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピペリジン-1-イル-フェニル] -ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 860 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.05 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.28 (2H, m), 1.37 (4H, m), 2.25 (3H, s), 2.62 (6H, m), 2.72 (2H, m), 2.84 (4H, m), 3.63 (2H, s), 6.87 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 6.99 (1H, m), 7.09 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.44 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.54 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.83 (2H, m), 7.88 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.98 (1H, s), 8.07 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.56 (1H, s), 11.19 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 585 (M-1)

化合物 861 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピペリジン-1-イル-フェニル] -ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 861 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.10 (6H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.30 (2H, m), 1.39 (4H, m), 2.25 (3H, s), 2.64-2.90 (12H, m), 3.62 (2H, s), 6.89 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.07 (2H, m), 7.27-7.65 (4H, m), 7.68-8.00 (3H, m), 8.11 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.53 (1H, s), 11.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 585 (M-1)

化合物 862 N- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデ

ン-ヒドラジノカルボニル) - 4-ピペリジン-1-イル-フェニル] - 3-  
 { [(2-ジエチルアミノ-エチル) - メチル-アミノ] - メチル} - ベンズア  
 ミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 862 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 1.23 (2H, m), 1.32 (4H, m), 2.27 (3H, s), 2.58 (6H, m), 2.67 (2H, m), 2.79 (4H, m), 3.64 (2H, s), 6.81 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 6.92 (1H, s), 7.47 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.57 (2H, m), 7.88 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.95 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.01 (1H, s), 8.06 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 8.10 (1H, s), 8.64 (1H, s), 11.08 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 669 ( $M-1$ )

化合物 863 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) - メチル-アミノ] -  
 メチル} - N- [2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)  
 - 4-ピペリジン-1-イル-フェニル] - ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 863 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.06 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.32 (2H, m), 1.43 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.62 (6H, m), 2.72 (2H, m), 2.90 (4H, m), 3.62 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.83-6.95 (3H, m), 7.05 (1H, s), 7.42 (1H, m), 7.52 (1H, m), 7.74 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.88 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.96 (1H, s), 8.18 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.48 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 597 ( $M-1$ )

化合物 864 N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカル  
 ボニル) - 4-ピペリジン-1-イル-フェニル] - 3- [4- (2-ヒドロキ  
 シ-エチル) - ピペラジン-1-イル-メチル] - ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物864を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.42 (4H, m), 1.32 (2H, m), 2.28 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.48–2.72 (10H, m), 2.88 (4H, m), 3.61 (4H, m), 6.92 (1H, m), 6.99 (1H, m), 7.16 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.44 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.51 (2H, m), 7.65 (1H, s), 7.90 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.99 (1H, s), 8.17 (1H, d,  $J=9.2\text{Hz}$ ), 8.43 (1H, s), 10.71 (1H, s), 11.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 595 (M-1)

化合物865 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物865を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.28 (2H, m), 1.39 (4H, m), 2.36 (3H, s), 2.48–2.90 (14H, m), 3.60 (4H, m), 6.88 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 6.99 (1H, s), 7.20 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.44 (1H, dd,  $J=7.6\text{Hz}$ ,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.51 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.72 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.99 (1H, s), 8.13 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.49 (1H, s), 10.95 (1H, s), 11.23 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 581 (M-1)

化合物866 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物866を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.27 (2H, m), 1.37 (4H, m), 2.55–2.90 (14H, m), 3.62 (2H, s),

3. 68 (2H, t,  $J=5.2$  Hz), 6. 88 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7. 00–7. 16 (2H, m), 7. 31–7. 60 (4H, m), 7. 70–8. 03 (3H, m), 8. 11 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 52 (1H, s), 11. 21 (1H, s), 11. 35 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 585 ( $M-1$ )

化合物 867 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 867 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 26 (2H, m), 1. 36 (4H, m), 2. 58 (10H, m), 2. 83 (4H, m), 3. 62 (4H, m), 6. 87 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 6. 98 (1H, s), 7. 08 (2H, dd,  $J=8.4$  Hz,  $J=8.4$  Hz), 7. 44 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7. 52 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 81 (2H, m), 7. 89 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 98 (1H, s), 8. 09 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 53 (1H, s), 11. 20 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 585 ( $M-1$ )

化合物 868 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 868 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 61 (2H, m), 1. 72 (4H, m), 2. 46–2. 65 (10H, m), 3. 22 (4H, m), 3. 63 (4H, m), 7. 20 (1H, dd,  $J=9.3$  Hz,  $J=2.7$  Hz), 7. 36 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7. 48 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7. 55 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 65 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 86 (1H, m), 7. 93 (1H, m),

8. 00 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8. 26 (1H, s), 8. 32 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 8. 36 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 669 (M-1)

化合物 869 3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 869 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 37 (2H, m), 1. 48 (4H, m), 2. 56 (10H, m), 2. 93 (4H, m), 3. 61 (4H, m), 3. 84 (3H, s), 6. 90-7. 04 (4H, m), 7. 44 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ ,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7. 51 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7. 76 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7. 89 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7. 98 (1H, s), 8. 23 (1H, m), 8. 38 (1H, m), 11. 21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 597 (M-1)

化合物 870 N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 870 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 32 (2H, m), 1. 43 (4H, m), 1. 63 (2H, m), 1. 90 (2H, m), 2. 29 (8H, m), 2. 80 (2H, m), 2. 88 (4H, m), 3. 63 (2H, s), 3. 72 (1H, m), 6. 91 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7. 02 (1H, s), 7. 15 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7. 35-7. 55 (3H, m), 7. 65 (1H, m), 7. 90 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7. 97 (1H, s), 8. 18 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 8. 44 (1H, s), 10. 79 (1H, s), 11. 24 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 566 (M-1)

化合物 871 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-

[2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物871を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.26 (2H, m), 1.40 (4H, m), 1.64 (2H, m), 1.89 (2H, m), 2.26 (2H, m), 2.35 (3H, s), 2.82 (6H, m), 3.63 (2H, s), 3.71 (1H, m), 6.89 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.04 (1H, s), 7.18 (2H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.43 (1H, m), 7.53 (1H, m), 7.69 (2H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 8.17 (1H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 8.47 (1H, s), 10.98 (1H, s), 11.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 552 (M-1)

化合物872 N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物872を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.32 (2H, m), 1.42 (4H, m), 1.66 (2H, m), 1.92 (2H, m), 2.40 (2H, m), 2.88 (6H, m), 3.71 (2H, s), 3.76 (1H, m), 6.90 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.98-7.11 (2H, m), 7.43 (1H, m), 7.54 (1H, m), 7.77 (2H, m), 7.89 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.96 (1H, s), 8.05 (1H, m), 8.15 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.47 (1H, s), 11.10-11.30 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 556 (M-1)

化合物873 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-3-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 873 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.34 (2H, m), 1.44 (4H, m), 1.67 (2H, m), 1.94 (2H, m), 2.34 (2H, m), 2.88 (6H, m), 3.70 (2H, s), 3.77 (1H, m), 6.92 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.09 (3H, m), 7.29–7.67 (4H, m), 7.90 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 8.14 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.49 (1H, s), 11.02 (1H, s), 11.17 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 556 (M-1)

**化合物 874** N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 874 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.50–1.68 (4H, m), 1.75 (4H, m), 1.84 (2H, m), 2.22 (2H, m), 2.81 (2H, m), 3.24 (4H, t,  $J=5.2\text{ Hz}$ ), 3.61 (3H, m), 7.22 (1H, dd,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.37 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, m), 7.57 (1H, m), 7.67 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.87 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 8.33 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.37 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 640 (M-1)

**化合物 875** 3-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イルメチル)-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 875 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.34 (2H, m), 1.45 (4H, m), 1.64 (2H, m), 1.90 (2H, m), 2.25 (2

H, m), 2.79 (2H, m), 2.91 (4H, m), 3.63 (2H, s), 3.72 (1H, m), 3.83 (3H, m), 6.92 (3H, m), 7.64 (1H, s), 7.33–7.50 (1H, m), 7.53 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.75 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.89 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.96 (1H, s), 8.22 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.42 (1H, s), 10.68 (1H, bs), 11.25 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 568 (M-1)

化合物 876 3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 876 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.33 (2H, m), 1.44 (4H, m), 2.29 (6H, m), 2.59 (6H, m), 2.71 (2H, m), 2.90 (4H, m), 3.84 (2H, s), 6.92 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.10 (1H, s), 7.16 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.44 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.53 (2H, m), 7.66 (1H, m), 7.89 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.18 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.44 (1H, s), 10.73 (1H, bs), 11.26 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 598 (M-1)

化合物 877 3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 877 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.08 (6H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.36 (2H, m), 1.46 (4H, m), 2.74 (6H, m), 2.84 (2H, m), 2.92 (4H, m), 3.83 (2H, s),



6.94 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.05 (2H, m), 7.42 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, m), 7.79 (2H, m), 7.88 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.98 (1H, s), 8.03 (1H, m), 8.17 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.47 (1H, s), 11.02 (1H, bs), 11.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 588 ( $M-1$ )

化合物 878 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジシン-1-イル-フェニル]-3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 878 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.03 (6H, m), 1.29 (2H, m), 1.38 (4H, m), 2.48-2.75 (8H, m), 2.84 (4H, m), 3.85 (2H, s), 6.90 (2H, m), 7.47 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.56 (2H, m), 7.88 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00-8.12 (4H, m), 8.60 (1H, s), 11.07 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 672 ( $M-1$ )

化合物 879 3-(2-ジエチルアミノ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジシン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 879 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.02 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.26 (2H, m), 1.67 (4H, m), 2.59 (6H, m), 2.70 (2H, m), 2.92 (4H, m), 3.83 (5H, m), 6.92 (3H, m), 7.02 (1H, s), 7.44 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.77 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.88 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.99 (1H, m), 8.22 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.42 (1H, s), 10.59 (1H, bs), 11.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 600 (M-1)

化合物 880 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 880 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.41 (2H, m), 1.51 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.67 (3H, s), 2.65 (2H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 2.94 (4H, m), 3.82 (2H, s), 3.93 (1H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 6.93 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.04 (1H, s), 7.14 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.52 (3H, m), 7.63 (1H, s), 7.80 (1H, s), 8.01 (1H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 8.25 (1H, s), 8.28 (2H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 10.56 (1H, s), 11.50 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 543 (M-1)

化合物 881 3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 881 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.43 (2H, m), 1.54 (4H, m), 2.33 (3H, s), 2.64 (2H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.97 (4H, m), 3.82 (2H, s), 3.92 (2H, m), 6.95 (1H, m), 7.08 (1H, s), 7.19 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.54 (2H, m), 7.69 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.79 (1H, s), 8.00 (1H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 8.26 (1H, s), 8.30 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 10.52 (1H, s), 11.49 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 529 (M-1)

化合物 882 N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチル

スルファニルメチル) - ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 882 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.44 (2H, m), 1.57 (4H, m), 2.64 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 2.99 (4H, m), 3.81 (2H, s), 3.91 (2H, m), 7.00 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.10 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.15 (1H, s), 7.54 (2H, m), 7.78 (1H, s), 7.86 (2H, m), 8.06 (1H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 8.33 (2H, m), 10.59 (1H, s), 11.48 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 ( $M-1$ )

化合物 883 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 883 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.44 (2H, m), 1.57 (4H, m), 2.65 (2H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 2.99 (4H, m), 3.82 (2H, s), 3.92 (2H, m), 6.80-7.22 (3H, m), 7.36 (1H, m), 7.53 (3H, m), 7.66 (1H, m), 7.80 (1H, s), 8.00 (1H, d,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 8.30 (2H, m), 10.65 (1H, s), 11.46 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 533 ( $M-1$ )

化合物 884 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 884 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.36 (2H, m), 1.44 (4H, m), 2.65 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.86 (4H, m), 3.82 (2H, s), 3.92 (2H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 6.90 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 6.97 (1H, s), 7.57 (3H,

m), 7.76 (1H, s), 8.04 (2H, d,  $J=6.8$  Hz), 8.14 (1H, d,  $J=9.8$  Hz), 8.23 (1H, s), 8.43 (1H, s), 11.09 (1H, s), 11.38 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 617 (M-1)

化合物 885 3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 885 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz) :  $\delta$  1.47 (2H, m), 1.62 (4H, m), 2.64 (2H, t,  $J=7.1$  Hz), 3.04 (4H, m), 3.80 (3H, s), 3.81 (2H, s), 3.92 (2H, m), 6.89 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.02 (1H, m), 7.24 (1H, m), 7.52 (2H, m), 7.76 (3H, m), 7.99 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 8.25 (1H, s), 8.40 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 10.50 (1H, s), 11.59 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 545 (M-1)

化合物 886 3-{3-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニルカルバモイル]-ベンジルスルファニル}-プロピオニック アシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 886 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz) :  $\delta$  1.37 (2H, m), 1.52 (4H, m), 2.20 (6H, s), 2.75 (2H, m), 2.84 (2H, m), 2.94 (4H, m), 3.94 (2H, s), 6.93 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.06 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.11 (1H, s), 7.38-7.52 (3H, m), 7.55 (1H, s), 7.94 (1H, s), 8.02 (1H, d,  $J=6.8$  Hz), 8.25 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.28 (1H, s), 10.85 (1H, s), 11.36 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 571 (M-1)

化合物 887 3- { 3- [ 2- ( 4-メチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル) - 4-ピペリジン-1-イル-フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -プロピオニック アシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 887 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.33 (2H, m), 1.47 (4H, m), 2.29 (3H, s), 2.70 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 2.80 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 2.90 (4H, m), 3.89 (2H, s), 6.91 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.12 (3H, m), 7.40-7.50 (2H, m), 7.61 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.93 (1H, s), 7.97 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 8.20 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.35 (1H, s), 11.03 (1H, s), 11.32 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 557 ( $M-1$ )

化合物 888 3- { 3- [ 2- ( 4-フルオローベンジリデンーヒドラジノカルボニル) - 4-ピペリジン-1-イル-フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -プロピオニック アシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 888 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.62 (2H, m), 1.74 (4H, m), 2.55 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.68 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 3.23 (4H, m), 3.86 (2H, s), 7.10-7.25 (3H, m), 7.36 (1H, d,  $J=2.9\text{ Hz}$ ), 7.47 (1H, dd,  $J=7.1\text{ Hz}$ ,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.85 (3H, m), 7.93 (1H, m), 8.32 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 561 ( $M-1$ )

化合物 889 3- { 3- [ 2- ( 4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル) - 4-ピペリジン-1-イル-フェニルカルバモイル] -ベンジルスルファニル} -プロピオニック アシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 889 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.62 (2H, m), 1.74 (4H, m), 2.54 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 2.68 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 3.22 (4H, m), 3.86 (2H, s), 7.22 (1H, m), 7.36 (1H, m), 7.48 (1H, dd,  $J=7.6\text{Hz}$ ,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.57 (1H, m), 7.67 (1H, m), 7.83 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.93 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.29 (2H, m), 8.36 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 646 ( $M-1$ )

化合物 890 3- { 3- [ 2- ( 4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-ピペリジン-1-イル-フェニルカルバモイル ] - ベンジルスルファニル } - プロピオニック アシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 890 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.35 (2H, m), 1.49 (4H, m), 2.71 (2H, m), 2.80 (2H, m), 2.92 (4H, m), 3.76 (3H, s), 3.89 (2H, s), 6.80 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.92 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.15 (1H, s), 7.45 (2H, m), 7.64 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.95 (2H, m), 8.24 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.31 (1H, s), 10.97 (1H, bs), 11.37 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 573 ( $M-1$ )

化合物 891 { 3- [ 2- ( 4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-ピペリジン-1-イル-フェニルカルバモイル ] - ベンジルスルファニル } - アセティック アシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 891 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.63 (2H, m), 1.75 (4H, m), 3.11 (2H, s), 3.24 (4H, m), 3.94 (2H, s), 7.22 (1H, dd,  $J=9.2\text{Hz}$ ,  $J=2.8\text{Hz}$ ), 7.37 (1H, d,  $J=2.7\text{Hz}$ ), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.67 (1H, d,

$J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.84 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.95 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 8.28 (2H, m), 8.37 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 631 (M-1)

化合物 892 {3-[2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニルカルバモイル]-ベンジルスルファニル}-アセティック アシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 892 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  1.39 (2H, m), 1.53 (4H, m), 2.93 (4H, m), 3.21 (2H, s), 3.77 (3H, s), 3.98 (2H, s), 6.82 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 6.93 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 7.22 (1H, s), 7.48 (2H, m), 7.63 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.82 (1H, s), 7.98 (1H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 8.25 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.32 (1H, s), 10.93 (1H, s), 11.43 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 893 3-(7,8-ジヒドロ-5H-1,6,9-トリアザ-アンスラセン-6-イルメチル)-N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 893 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz):  $\delta$  1.32 (2H, m), 1.40 (4H, m), 2.22 (6H, s), 2.83 (4H, m), 2.97 (2H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 3.31 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 3.84 (4H, s), 6.92 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.09 (2H, m), 7.35 (1H, m), 7.45 (2H, m), 7.61 (2H, m), 7.77 (1H, s), 7.95 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 8.02 (2H, m), 8.26 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.49 (1H, s), 8.97 (1H, dd,  $J=4.3\text{ Hz}$ ,  $J=1.8\text{ Hz}$ ), 11.05 (1H, s), 11.41 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 650 (M-1)

化合物 894 3-(7, 8-ジヒドロ-5H-1, 6, 9-トリアザ-アンスラセン-6-イルメチル)-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 894 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.31 (2H, m), 1.39 (4H, m), 2.33 (3H, s), 2.82 (4H, m), 2.97 (2H, m); 3.31 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 3.84 (4H, m), 6.92 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.07 (1H, s), 7.15 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.35 (1H, m), 7.47 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.65 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.77 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 8.02 (2H, m), 8.26 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.52 (1H, s), 8.97 (1H, dd,  $J=4.3\text{ Hz}$ ,  $J=1.8\text{ Hz}$ ), 11.08 (1H, s), 11.39 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 636 (M-1)

化合物 895 3-(7, 8-ジヒドロ-5H-1, 6, 9-トリアザ-アンスラセン-6-イルメチル)-N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 895 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.20-1.40 (6H, m), 2.75 (4H, m), 2.94 (2H, m), 3.25 (2H, m), 3.82 (2H, s), 3.83 (2H, s), 6.89 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.00 (2H, m), 7.10 (1H, s), 7.37 (1H, m), 7.46 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.70 (2H, m), 7.77 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.04 (2H, m), 8.26 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.61 (1H, s), 8.94 (1H, m), 11.45-11.75 (2H, m)



質量分析 (ESI-MS) 640 (M-1)

化合物 896 3-(7, 8-ジヒドロ-5H-1, 6, 9-トリアザ-アンスラセン-6-イルメチル)-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド  
実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 896 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.29 (2H, m), 1.36 (4H, m), 2.79 (4H, m), 2.97 (2H, m), 3.28 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 3.84 (2H, s), 3.85 (2H, s), 6.90 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.03 (1H, m), 7.09 (1H, s), 7.28-8.00 (5H, m), 7.61 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.77 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.05 (2H, m), 8.22 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.60 (1H, s), 8.97 (1H, dd,  $J=4.1\text{ Hz}$ ,  $J=2.0\text{ Hz}$ ), 11.38 (1H, s), 11.55 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 640 (M-1)

化合物 897 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-3-(7, 8-ジヒドロ-5H-1, 6, 9-トリアザ-アンスラセン-6-イルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 897 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.30 (2H, m), 1.37 (4H, m), 2.80 (4H, m), 2.97 (2H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 3.30 (2H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 3.86 (4H, m), 6.90 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.02 (1H, s), 7.38 (1H, m), 7.51 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.78 (1H, s), 7.94 (2H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.06 (2H, m), 8.17 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.61 (1H, s), 8.98 (1H, m), 11.25 (1H, s), 11.46 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 724 (M-1)

化合物 898 3-(7, 8-ジヒドロ-5H-1, 6, 9-トリアザ-アンスラセン-6-イルメチル)-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド  
実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 898 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.31 (2H, m), 1.39 (4H, m), 2.83 (4H, m), 2.97 (2H, m), 3.30 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 3.78 (5H, m), 3.83 (2H, s), 6.85 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 6.92 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.09 (1H, s), 7.35 (1H, m), 7.46 (1H, t,  $J=7.7$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.67 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.76 (1H, s), 7.94 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 8.02 (2H, m), 8.28 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.49 (1H, s), 8.96 (1H, m), 11.08 (1H, bs), 11.44 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 652 (M-1)

化合物 899 3-(2, 3-ジヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 899 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.62 (2H, m), 1.75 (4H, m), 2.29 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.50 (1H, m), 2.63 (1H, m), 3.23 (4H, m), 3.56 (2H, m), 3.74 (1H, m), 3.88 (2H, s), 7.21 (2H, m), 7.37 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.53 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.65 (1H, s), 7.85 (1H, m), 7.93 (1H, m), 8.29 (1H, s), 8.37 (1H, d,  $J=9.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 573 (M-1)

化合物 900 3-(2,3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-  
N-[2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリ  
ジンを1-イルフェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 900 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.57 (2H, m), 1.67 (4H, m), 2.35 (3H, s), 2.40 (1H, m), 2.58 (1H, m), 3.15-3.36 (6H, m), 3.60 (1H, m), 3.86 (2H, s), 4.55 (1H, m), 4.81 (1H, m), 7.19 (1H, m), 7.28 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.32 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.53 (2H, m), 7.65 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.77 (1H, m), 7.87 (1H, s), 8.29 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.41 (1H, s), 11.42 (1H, bs), 11.95 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 901 3-(2,3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-  
N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペ  
リジンを1-イルフェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 901 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CD $_3$ OD, 400 MHz) :  $\delta$  1.62 (2H, m), 1.74 (4H, m), 2.50 (1H, m), 2.62 (1H, m), 3.23 (4H, m), 3.55 (2H, m), 3.75 (1H, m), 3.88 (2H, s), 7.17 (2H, dd,  $J=8.7\text{ Hz}$ ,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.22 (1H, dd,  $J=9.0\text{ Hz}$ ,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.37 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.48 (1H, dd,  $J=7.5\text{ Hz}$ ,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.80-7.95 (4H, m), 8.34 (1H, s), 8.37 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

化合物 902 3-(2,3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-

N-〔2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル〕-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物902を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz) :  $\delta$  1.57 (2H, m), 1.67 (4H, m), 2.04 (1H, m), 2.58 (1H, m), 3.19-3.40 (6H, m), 3.60 (1H, m), 3.86 (2H, s), 4.54 (1H, t,  $J=5.7\text{Hz}$ ), 4.80 (1H, d,  $J=3.5\text{Hz}$ ), 7.20 (1H, m), 7.29 (2H, m), 7.44-7.64 (5H, m), 7.76 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.87 (1H, s), 8.25 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.44 (1H, s), 11.30 (1H, s), 12.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 563 (M-1)

化合物903 N-〔2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル〕-3-(2,3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物903を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  1.63 (2H, m), 1.75 (4H, m), 2.50 (1H, m), 2.62 (1H, m), 3.24 (4H, m), 3.54 (2H, m), 3.74 (1H, m), 3.88 (2H, s), 7.23 (1H, dd,  $J=9.1\text{Hz}$ ,  $J=2.8\text{Hz}$ ), 7.38 (1H, d,  $J=2.7\text{Hz}$ ), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.68 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.84 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.93 (1H, s), 8.06 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 8.34 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.37 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 647 (M-1)

化合物904 3-(2,3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-N-〔2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル〕-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物904を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz) :  $\delta$  1.57 (2H, m), 1.68 (4H, m), 2.40 (1H, m), 2.58 (1H, m), 3.15–3.40 (6H, m), 3.61 (1H, m), 3.82 (3H, s), 3.86 (2H, s), 7.02 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.21 (1H, m), 7.33 (1H, m), 7.53 (2H, m), 7.70 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.77 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.87 (1H, s), 8.31 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 11.44 (1H, s), 11.87 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 575 ( $M-1$ )

化合物905 3- { [ビス-(2-ジエチルアミノエチル) -アミノ] -メチル} -N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル] -ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物905を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  0.99 (12H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 1.44 (2H, m), 1.57 (4H, m), 2.30 (6H, s), 2.50 (8H, m), 2.61 (8H, m), 3.00 (4H, m), 3.73 (2H, s), 7.02 (2H, m), 7.18 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.42 (1H, dd,  $J=7.6\text{Hz}$ ,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.51 (1H, m), 7.57 (1H, m), 7.67 (1H, s), 7.87 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 8.32 (2H, m), 11.14 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 681 ( $M-1$ )

化合物906 3- { [ビス-(2-ジエチルアミノエチル) -アミノ] -メチル} -N-[2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル] -ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物906を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.00 (12H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 1.25 (2H, m), 1.34 (4H, m), 2.37 (3H,

s), 2.51 (8H, m), 2.62 (8H, m), 2.80 (4H, m), 3.75 (2H, s), 6.85 (1H, m), 6.97 (1H, m), 7.20 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.43 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.75 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.86 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.08 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.59 (1H, s), 11.20 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 667 ( $M-1$ )

化合物907 3- { [ビス-(2-ジエチルアミノ-エチル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物907を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.00 (12H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.26 (2H, m), 1.35 (4H, m), 2.51 (8H, m), 2.62 (8H, m), 2.81 (4H, m), 3.75 (2H, s), 6.85 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 6.94 (1H, s), 7.10 (2H, dd,  $J=8.5\text{ Hz}$ ,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.44 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.85 (3H, m), 8.00 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.61 (1H, s), 11.14 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 671 ( $M-1$ )

化合物908 3- { [ビス-(2-ジエチルアミノ-エチル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物908を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.00 (12H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.24 (2H, m), 1.33 (4H, m), 2.51 (8H, m), 2.62 (8H, m), 2.78 (4H, m), 3.76 (2H, s), 6.84 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 6.91 (1H, s), 7.11 (1H, m), 7.34-7.48 (2H, m), 7.58-7.68 (3H, m),

7. 87 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8. 00 (2H, m), 8. 61 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 671 (M-1)

化合物 909 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピペリジン-1-イル-フェニル] -ベンズアミド  
実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 909 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 00 (12H, t,  $J=7.1$  Hz), 1. 21 (2H, m), 1. 30 (4H, m), 2. 51 (8H, m), 2. 62 (8H, m), 2. 75 (4H, m), 3. 77 (2H, s), 6. 80 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 6. 88 (1H, s), 7. 47 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7. 57 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7. 64 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 86 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 91 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 02 (1H, s), 8. 08 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 8. 12 (1H, s), 8. 67 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 754 (M-1)

化合物 910 3- { [ビス- (2-ジエチルアミノ-エチル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピペリジン-1-イル-フェニル] -ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 910 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1. 00 (12H, t,  $J=7.1$  Hz), 1. 28 (2H, m), 1. 38 (4H, m), 2. 51 (8H, m), 2. 61 (8H, m), 2. 83 (4H, m), 3. 75 (2H, s), 3. 84 (3H, s), 6. 85-7. 00 (4H, m), 7. 43 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7. 59 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 79 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7. 86 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 99 (1H, s), 8. 12 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8. 51 (1H, s), 11. 19 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 682 (M-1)

### 実施例 G

化合物 911 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ジプロピルアミノ-フェニル]-3-([ (2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル)-ベンズアミド

5-アミノ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (化合物 A') (800 mg) を乾燥 THF (15 ml) に溶解した。これに、室温で 3 M 硫酸 (4 ml) と THF (1 ml) の混合液に溶解したプロピオンアルデヒド (化合物 D) (870  $\mu$ l) を加え、続いて 0℃ にて水素化ホウ素ナトリウム (231 mg) を加え、室温で 3 時間攪拌した。その後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2-ニトロ-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した (608 mg、収率 63%)。

上記反応で得られた、2-ニトロ-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (608 mg) を乾燥 THF (15 ml) に溶解し、室温で 3 M 硫酸 (2.1 ml) と THF (1 ml) の混合液に溶解したプロピオンアルデヒド (化合物 D) (461  $\mu$ l) を加え、続いて 0℃ にて水素化ホウ素ナトリウム (145 mg) を加え、室温で 3 時間攪拌した。その後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、5-ジプロピルアミノ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した (149 mg、収率 21%)。

上記反応で得られた、5-ジプロピルアミノ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (467 mg) をエタノール (5 ml) に溶解し、10%パラジウム-炭素 (45 mg) を加えた後、水素置換し、室温で 15 時間攪



拌した。反応終了後、セライトろ過し、濃縮を行い、得られた残渣をヘキサノーアセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2-アミノ-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステル（化合物A）（243mg、収率58%）を製造した。

上記反応で得られた、2-アミノ-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステル（化合物A）（243mg）を、無水塩化メチレン（3.0ml）に溶解させた。続いて、0℃にてピリジン（170 $\mu$ l）、3-（クロロメチル）ベンゾイルクロライド（化合物B）（166 $\mu$ l）をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサノーアセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2-（3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ）-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した（280mg、収率64%）。

上記反応で得られた、2-（3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ）-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステル（280mg）を、無水塩化メチレン（2.0ml）に溶解させ、室温にてトリエチルアミン（45 $\mu$ l）、N,N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン（化合物B'）（50 $\mu$ l）を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサノーアセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2-（3-〔（2-ジエチルアミノ-エチル）-メチル-アミノ〕-メチル}-ベンゾイルアミノ）-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した（164mg、収率50%）。

上記反応で得られた、2-（3-〔（2-ジエチルアミノ-エチル）-メチル-アミノ〕-メチル}-ベンゾイルアミノ）-5-ジプロピルアミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステル（164mg）を、エタノール（5.0ml）に溶解させ、ヒドラジン-水和物（200 $\mu$ l）を加え、加熱還流下で15時間

攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、ヒドラジン化合物、3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- (4-ジプロピルアミノ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニル) -ベンズアミドを製造した (96 mg、収率58%)。

上記反応で得られたヒドラジン化合物、3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- (4-ジプロピルアミノ-2-ヒドラジノカルボニル-フェニル) -ベンズアミド (47 mg) を、無水トルエン (1.0 ml) に溶解させ、室温にて3-トリフルオロメチルー4-クロロベンズアルデヒド (化合物C) (40  $\mu$ l) を添加し、室温で15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物911を製造した (57 mg、収率88%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.78 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.04 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.37 (4H, m), 2.26 (3H, s), 2.50-2.75 (8H, m), 2.85 (4H, m), 3.62 (2H, s), 6.49 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 6.65 (1H, s), 7.44 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.55 (2H, m), 7.80-8.15 (5H, m), 8.63 (1H, s), 10.83 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 685 ( $M-1$ )

化合物912 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [4-ジプロピルアミノ-2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例Gとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物912を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.81 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.05 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.42 (4H, m), 2.24 (3H, s), 2.50-2.70 (8H, m), 2.95 (4H, m), 3.61 (2H, s), 3.83 (3H, s), 6.57 (1H, d,  $J=9.$

0 Hz), 6.72 (1H, s), 6.91 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.41 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.52 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.76 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.85 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.95 (1H, s), 8.05 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.45 (1H, s), 10.93 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 614 ( $M-1$ )

化合物 913 3-({2-[ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-エチルアミノ}-メチル)-N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド  
実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 913 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.41 (2H, m), 1.52 (4H, m), 2.25 (6H, s), 2.61 (4H, m), 2.71 (2H, m), 2.77 (2H, m), 2.97 (4H, m), 3.58 (4H, t,  $J=4.8$  Hz), 3.92 (2H, s), 6.94 (1H, m), 7.07 (1H, s), 7.13 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.40-7.55 (3H, m), 7.60 (1H, s), 7.93 (2H, m), 8.22 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 8.38 (1H, s), 11.20 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 613 ( $M-1$ )

化合物 914 3-({2-[ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-エチルアミノ}-メチル)-N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 914 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  1.44 (2H, m), 1.54 (4H, m), 2.60 (4H, m), 2.73 (2H, m), 2.86 (2H, m), 3.00 (4H, m), 3.56 (4H, m), 3.97 (2H, m), 6.90 (1H, m), 7.10 (1H, m), 7.73-7.55 (4H, m), 7.92 (2H, m), 8.02 (1H, m), 8.15 (1H, m), 8.60 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 687 (M-1)

化合物 915 3-({2-[ビス-(2-ヒドロキシーエチル)-アミノ]-エチルアミノ}-メチル)-N-[2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド  
実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 915 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.40 (2H, m), 1.51 (4H, m), 2.61 (4H, m), 2.70 (2H, m), 2.76 (2H, m), 2.96 (4H, m), 3.58 (4H, m), 3.81 (3H, s), 3.90 (2H, s), 6.88 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 6.93 (1H, m), 7.07 (1H, s), 7.43 (1H, m), 7.50 (1H, m), 7.72 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.92 (2H, m), 8.22 (1H, m), 8.36 (1H, s), 11.22 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 615 (M-1)

化合物 916 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピロリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 916 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.06 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.99 (4H, m), 2.26 (9H, m), 2.58 (2H, m), 2.70 (4H, m), 2.82 (2H, m), 3.30 (4H, m), 3.63 (2H, s), 6.75 (1H, dd,  $J=9.2\text{ Hz}$ ,  $J=2.8\text{ Hz}$ ), 6.90 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.14 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.47 (2H, m), 7.54 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.57 (1H, s), 7.85 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, s), 8.24 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 581 (M-1)

化合物 917 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピロリジン-1-イル-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズア

ミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 917 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.02 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 1.99 (4H, m), 2.25 (3H, s), 2.57 (6H, m), 2.70 (2H, m), 3.30 (4H, m), 3.62 (2H, s), 6.74 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.7$  Hz), 6.89 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.47 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.54 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.84 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.93 (2H, m), 8.18 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.23 (1H, m), 8.35 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 655 ( $M-1$ )

化合物 918 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピロリジン-1-イル-フェニル] -ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 918 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.00 (4H, m), 2.26 (3H, s), 2.52-2.68 (6H, m), 2.75 (2H, m), 3.31 (4H, m), 3.64 (2H, s), 3.81 (3H, s), 6.75 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.7$  Hz), 6.89 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 6.93 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.47 (1H, t,  $J=7.7$  Hz), 7.54 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.73 (2H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.85 (1H, m), 7.91 (1H, s), 8.25 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.28 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 583 ( $M-1$ )

化合物 919 N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-ピロリジン-1-イル-フェニル] -3- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物919を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  2.06 (4H, m), 2.29 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.57 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 3.37 (4H, m), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 3.85 (2H, s), 6.81 (1H, d,  $J=8.1\text{Hz}$ ), 6.93 (1H, s), 7.02–7.23 (2H, m), 7.45–7.59 (2H, m), 7.64 (1H, s), 7.84 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, s), 8.26 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 529 (M-1)

化合物920 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピロリジン-1-イル-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物920を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  2.07 (4H, m), 2.57 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 3.38 (4H, m), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 3.85 (2H, s), 6.83 (1H, m), 6.94 (1H, m), 7.48 (1H, dd,  $J=7.7\text{Hz}$ ,  $J=7.7\text{Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.67 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.83 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.90 (1H, s), 8.04 (1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 8.22 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.32 (1H, s), 8.36 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 603 (M-1)

化合物921 3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピロリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物921を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  2.05 (4H, m), 2.57 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 3.36 (4H, m), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{Hz}$ ), 3.84 (5H, m), 6.81 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ )

z), 6.93 (1H, s), 6.97 (2H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.47 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.57 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.77 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.83 (1H, d,  $J=7.2$  Hz), 7.90 (1H, s), 8.24 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.27 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 531 (M-1)

化合物 922 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-メチル-[1,4]ジアゼパン-1-イル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 922 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.67 (2H, m), 2.20-2.80 (18H, m), 3.04 (2H, m), 3.11 (2H, m), 3.63 (2H, s), 6.57 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 6.64 (1H, s), 7.46 (1H, m), 7.57 (2H, m), 7.78 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.94 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.00 (1H, s), 8.08 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8.13 (1H, s), 8.64 (1H, s), 10.87 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 698, 699 (M-1)

化合物 923 N-{2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-[4-(2-ヒドロキシーエチル)-ピペラジン-1-イル]-フェニル}-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 923 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.57 (2H, t,  $J=7.0$  Hz), 2.60 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 2.72 (4H, m), 3.31 (4H, m), 3.68 (2H, t,  $J=7.0$  Hz), 3.73 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 3.85 (2H, s), 7.23 (1H, dd,  $J=9.$

0 Hz,  $J=2.7$  Hz), 7.38 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.48 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.67 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.84 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.91 (1H, s), 8.02 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 8.31 (1H, m), 8.37 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 662 ( $M-1$ )

化合物 924 N- {2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- [4- (2-ヒドロキシ-エチル) -ピペラジン-1-イル] -フェニル} -3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 924 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.01 (6H, t,  $J=7.2$  Hz), 2.26 (3H, s), 2.58 (8H, m), 2.70 (6H, m), 3.32 (4H, m), 3.64 (2H, s), 3.73 (2H, t,  $J=5.9$  Hz), 7.22 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=2.7$  Hz), 7.39 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.57 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.65 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.87 (1H, m), 7.93 (1H, s), 7.99 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 8.28 (1H, m), 8.36 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 714 ( $M-1$ )

化合物 925 1- {3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- [3- (2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル) -ベンゾイルアミノ] -フェニル} -ピペリジン-3-カルボキシリックアシッド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 925 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.54-3.90 (15H, m), 7.24 (1H, m), 7.37 (1H, s), 7.54 (2H, m), 7.77 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.82 (1H, d,  $J=8.$



3 Hz), 7.87 (1H, s), 8.05 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 8.22 (2H, m), 8.54 (1H, s), 11.23 (1H, s), 12.34 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 684 ( $M+23$ )

化合物 926 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-チオモルホリン-4-イルフェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 926 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.27 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.73 (4H, m), 3.32-3.60 (8H, m), 3.85 (2H, s), 7.22 (2H, m), 7.31 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.43-7.59 (4H, m), 7.77 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.87 (1H, s), 8.30 (1H, m), 8.36 (1H, s), 11.38 (1H, s), 11.91 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 561 ( $M-1$ )

化合物 927 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-チオモルホリン-4-イルフェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 927 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.72 (4H, m), 3.31 (2H, m), 3.56 (6H, m), 3.84 (2H, s), 4.79 (1H, m), 7.20 (1H, m), 7.29 (1H, m), 7.53 (2H, m), 7.77 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.80 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.86 (1H, s), 8.05 (1H, m), 8.21 (1H, s), 8.25 (1H, m), 8.48 (1H, s), 11.20 (1H, s), 12.21 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 635 ( $M-1$ )

化合物 928 3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-チオモルホリ

ン-4-イル-フェニル] -ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物928を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  2.73 (4H, m), 3.35 (2H, m), 3.50-3.60 (6H, m), 3.82 (3H, s), 3.85 (2H, s), 7.03 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.20 (1H, dd,  $J=9.1\text{Hz}$ ,  $J=2.8\text{Hz}$ ), 7.31 (1H, d,  $J=2.7\text{Hz}$ ), 7.54 (2H, m), 7.71 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.77 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.87 (1H, s), 8.31 (1H, d,  $J=9.3\text{Hz}$ ), 8.38 (1H, s), 11.42 (1H, s), 11.87 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 563 ( $M-1$ )

化合物929 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-チオモルホリン-4-イル-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物929を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.25 (6H, s), 2.28 (3H, s), 2.44 (4H, m), 2.56-2.76 (8H, m), 3.25 (4H, m), 3.65 (2H, s), 6.84 (1H, m), 7.00 (1H, s), 7.43-7.60 (3H, m), 7.88 (1H, m), 7.95-8.11 (4H, m), 8.60 (1H, s), 11.10 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 687 ( $M-1$ )

#### 実施例H

化合物930 N-[5-ブromo-3-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-2-イル]-3-ジメチルアミノメチル-ベンズアミド

2-アミノ-チオフエン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステル (化合物A) (3.0g) を、無水塩化メチレン (100ml) に溶解させた。続いて、 $0^\circ\text{C}$  にてピリジン (2.4ml)、3-(クロロメチル) ベンゾイルク

ロライド (化合物B) (2.8 ml) をそれぞれ加え、0℃にて1時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水を用いて洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-1-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステルを製造した (4.7 g、収率100%)。

上記反応で得られた、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-1-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステル (2.0 g) を、無水塩化メチレン (60 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (3 ml)、ジメチルアミン ハイドロクロライド (化合物B') (1.1 g) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、2-(3-ジメチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-1-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステルを製造した (1.14 g、収率52%)。

上記反応で得られた、2-(3-ジメチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-1-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステル (1.14 g) を、モノクロロベンゼンに溶解し、N-ブロモスクシンイミド (877 mg)、2, 2'-アゾビスイソブチロニトリル (81 mg) を加え、90℃で2時間攪拌した。反応終了後、濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である、5-ブロモ-2-(3-ジメチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-1-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステルを製造した (706 mg、収率54%)。

上記反応で得られた、5-ブロモ-2-(3-ジメチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-1-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステル (706 mg) をエタノール (10 ml) に溶解させ、ヒドラジン-水和物 (1 ml) を加え、室温で15時間攪拌した。反応終了後、室温にて水を加えクロロ

ホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、ヒドラジン化合物、N-(5-ブロモ-3-ヒドラジノカルボニル-チオフェン-2-イル)-3-ジメチルアミノメチル-ベンズアミドを製造した(448mg、収率64%)。

上記反応で得られたヒドラジン化合物、N-(5-ブロモ-3-ヒドラジノカルボニル-チオフェン-2-イル)-3-ジメチルアミノメチル-ベンズアミド(50mg)を、無水トルエン(1.0ml)に溶解させ、室温にてp-メトキシベンズアルデヒド(化合物C)(60 $\mu$ l)を添加し、室温で15時間攪拌した。反応終了後、クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物930を製造した(29mg、収率45%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz):  $\delta$  2.22 (6H, s), 3.67 (2H, s), 3.78 (3H, s), 6.84 (2H, m), 7.42 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.54-7.61 (3H, m), 7.89 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.93 (1H, s), 8.22 (1H, s), 9.87 (1H, bs), 12.93 (1H, bs)

質量分析 (ESI-MS) 515 (M-1)

化合物931 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-メチル-[1,4]ジアゼパン-1-イル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物931を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz):  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 1.73 (2H, m), 2.24 (5H, m), 2.37 (2H, m), 2.44-2.60 (9H, m), 2.65 (2H, m), 3.12 (2H, m), 3.20 (2H, m), 3.61 (2H, s), 3.84 (3H, s), 6.62 (1H, m), 6.69-6.78 (2H, m), 6.92 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.41 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.80 (2H, d,  $J=$

8. 1 Hz), 7. 96 (1H, s), 8. 08 (1H, d,  $J=9. 0$  Hz), 8. 49 (1H, s), 11. 01 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 626 (M-1)

化合物 932 3-[(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン)-アミノ]-2-[3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-フェニル]-6-(4-メチル-[1, 4]ジアゼパン-1-イル)-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 932 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  2. 10 (2H, m), 2. 42 (3H, s), 2. 55-2. 68 (4H, m), 2. 80 (2H, m), 3. 58-3. 84 (8H, m), 7. 23 (1H, m), 7. 34-7. 44 (3H, m), 7. 54 (2H, m), 7. 68 (2H, m), 7. 76 (1H, m), 7. 95 (1H, d,  $J=1. 7$  Hz), 9. 36 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 652 (M+23)

化合物 933 2-(3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-フェニル)-3-[(4-メトキシ-ベンジリデン)-アミノ]-6-(4-メチル-[1, 4]ジアゼパン-1-イル)-3H-キナゾリン-4-オン

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 933 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  0. 99 (6H, t,  $J=7. 2$  Hz), 2. 06 (2H, m), 2. 11 (3H, s), 2. 39 (3H, s), 2. 45-2. 60 (10H, m), 2. 76 (2H, m), 3. 51 (2H, s), 3. 62 (2H, t,  $J=6. 3$  Hz), 3. 70 (2H, m), 3. 84 (3H, s), 6. 90 (2H, d,  $J=8. 8$  Hz), 7. 22 (1H, dd,  $J=9. 0$  Hz,  $J=3. 2$  Hz), 7. 35 (1H, m), 7. 44 (1H, d,  $J=3. 2$  Hz), 7. 57 (1H, m), 7. 60-7. 70 (4H, m), 8. 88 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 632 (M+23)

化合物 934 1-{3-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカル

ボニル) - 4 - [ 3 - ( 2 - ヒドロキシーエチルスルファニルメチル) - ベンゾ  
イルアミノ] - フェニル} - ピペリジン - 3 - カルボキシリック アシッド  
実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 934 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  1.50 - 3.88 (21 H, m), 7.14 - 7.60 (7 H, m), 7.77 (1 H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7.87 (1 H, s), 8.32 (1 H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.40 (1 H, s), 11.44 (1 H, s), 12.01 (1 H, s)

質量分析 (ESI-MS) 609 ( $M+23$ )

#### 実施例 I

化合物 935 N - [ 2 - ( 3, 4 - ジメチルーベンジリデン - ヒドラジノカル  
ボニル) - 4 - ピペリジン - 1 - イルーフェニル] - 3, 4 - ジメトキシベン  
ズアミド

5 - クロロ - 2 - ニトロ - ベンゾイックアシッド (化合物 A') (10.0 g) をエタノール (100 ml) に溶解させ、 $0^\circ\text{C}$  にてチオニルクロライド (20 ml) を滴下した後、加熱還流下にて 48 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮し得られた残渣に蒸留水を加え、氷冷下飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて中和した後、酢酸エチルを用いて分液抽出を行った。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム - メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である 5 - クロロ - 2 - ニトロ - ベンゾイックアシッド エチルエステル (11.0 g、収率 97%) を得た。

上記製造方法にて得られた、5 - クロロ - 2 - ニトロ - ベンゾイックアシッド エチルエステル (3.1 g) を N, N - ジメチルホルムアミド (30 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (3.8 g) およびピペリジン (化合物 D) (2.8 ml) を添加した後、加熱還流下にて 12 時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え酢酸エチルにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、未精製の 2 - ニトロ - 5 - ピペリジン - 1 - イルーベンゾイックアシッド エチルエステル (3.81 g、粗収率 100%) を得た。

続いて、未精製の2-ニトロ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (3.8 g) をメタノール (35 ml) に溶解させ、室温にて酸化白金 (300 mg) を添加し、反応系内を水素にて置換した後12時間攪拌した。反応終了後、系内を窒素にて置換した後、セライト濾過により酸化白金を除去し、続いて減圧下にて濃縮することにより、有用中間体である未精製の2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (化合物A) (3.4 g、粗収率100%) を得た。

続いて、未精製の2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (化合物A) (1.3 g) を無水塩化メチレン (100 ml) に溶解させ、0℃にてトリエチルアミン (5.6 ml) および3,4-ジメトキシ-ベンゾイルクロライド (化合物B) (1.8 g) を添加し、室温にて24時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-クロロホルム系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-(3,4-ジメトキシ-ベンゾイルアミノ)-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (960 mg、収率52%) を得た。

上記方法にて製造した、2-(3,4-ジメトキシ-ベンゾイルアミノ)-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (380 mg) をエタノール (10 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (3 ml) を滴下し90℃にて1時間30分攪拌した。反応終了後、放冷し析出した結晶を桐山ロートにて分取することによって、有用中間体であるN-(2-ヒドラジノカルボニル-4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド (270 mg、収率71%) を得た。

続いて、上記方法にて得られたN-(2-ヒドラジノカルボニル-4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド (56 mg) を無水トルエン (5 ml) に溶解させ、室温にて3,4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物C) (40 mg) および触媒量の酢酸を滴下し90℃にて16時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機

層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物 935 (74 mg、収率 96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.32 (1H, d,  $J=9.2$  Hz), 8.28 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.59 (1H, d,  $J=2.2$  Hz,  $J=8.3$  Hz), 7.54 (1H, d,  $J=1.9$  Hz), 7.52 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.36 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.17–7.24 (2H, m), 7.06 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 3.92 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.20–3.25 (4H, m), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s), 1.70–1.80 (4H, m), 1.57–1.66 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 513, 514 ( $M-1$ )      537, 538 ( $M+23$ )

**化合物 936** 3, 4-ジメトキシ-N-[4-ピペリジン-1-イル-2-(ピリジン-3-イルメチルエネ-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 I とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 936 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.89 (1H, s), 8.55–8.60 (1H, m), 8.39 (1H, s), 8.34–8.39 (1H, m), 8.28 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.48–7.61 (3H, m), 7.37 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.22 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.3$  Hz), 7.06 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 3.91 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.20–3.25 (4H, m), 1.70–1.80 (4H, m), 1.57–1.66 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 486 ( $M-1$ )

**化合物 937** N-[2-(1H-イミダゾール-2-イルメチルエネ-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-3, 4-ジメトキシベンズアミド

実施例 I とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 937 を得た。



$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.34 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 7.03–7.62 (8H, m), 3.93 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.15–3.19 (4H, m), 1.55–1.84 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 475 ( $M-1$ )

化合物 938 N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 I とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 938 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.32 (1H, d,  $J=9.3\text{Hz}$ ), 8.24 (1H, s), 7.71 (1H, d,  $J=1.7\text{Hz}$ ), 7.59 (1H, dd,  $J=1.9\text{Hz}$ ,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.56 (1H, d,  $J=2.0\text{Hz}$ ), 7.36 (1H, d,  $J=2.9\text{Hz}$ ), 7.22 (1H, dd,  $J=2.9\text{Hz}$ ,  $J=9.3\text{Hz}$ ) 7.05–7.11 (2H, m), 6.82 (1H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 3.94 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.90 (3H, s), 3.21–3.25 (4H, m), 1.71–1.80 (4H, m), 1.58–1.67 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 529, 531, 532 ( $M-1$ )      555 ( $M+23$ )

化合物 939 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-モルホリン-4-イル-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 I とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 939 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) :  $\delta$  8.37 (1H, d,  $J=9.3\text{Hz}$ ), 8.28 (1H, s), 7.65 (1H, s), 7.60 (1H, dd,  $J=2.2\text{Hz}$ ,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.56 (1H, d,  $J=2.2\text{Hz}$ ), 7.50–7.55 (1H, m), 7.37 (1H, d,  $J=2.7\text{Hz}$ ), 7.21–7.26 (1H, m), 7.20 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.08 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 3.92 (3H, s), 3.9

1 (3H, s), 3.85–3.89 (4H, m), 3.20–3.29 (4H, m), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 515 (M-1)

化合物 940 N-[2-(4-ヒドロキシ-3-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-モルホリン-4-イル-フェニル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

実施例 I とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 940 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz):  $\delta$  11.6 (1H, bs), 8.27–8.40 (2H, m), 7.55–7.62 (2H, m), 7.47–7.53 (1H, m), 7.40–7.44 (1H, m), 6.88–7.16 (4H, m), 3.98 (3H, s), 3.97 (3H, s), 3.94 (3H, s), 3.60–3.72 (4H, m), 2.97–3.05 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 533, 534, 535 (M-1) 1067 (2M-1)

化合物 941 3,4-ジメトキシ-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-モルホリン-4-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例 I とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 941 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  8.28–8.32 (1H, m), 7.83–7.89 (1H, m), 7.73–7.82 (2H, m), 7.53–7.66 (3H, m), 7.20–7.30 (1H, m), 7.05–7.12 (1H, m), 6.96–7.04 (2H, m), 3.83–3.95 (13H, m), 3.29–3.35 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 519, 520 (M+1)

#### 実施例 J

化合物 942 3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イル-フェニル]-ベンズアミド

5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド (化合物 A') (10.0

g) をエタノール (100 ml) に溶解させ、0℃にてチオニルクロライド (20 ml) を滴下した後、加熱還流下にて48時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮し得られた残渣に蒸留水を加え、氷冷下飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて中和した後、酢酸エチルを用いて分液抽出を行った。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド エチルエステル (11.0 g、収率97%) を得た。

上記製造方法にて得られた、5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド エチルエステル (3.1 g) をN, N-ジメチルホルムアミド (30 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (3.8 g) およびピペリジン (化合物D) (2.8 ml) を添加した後、加熱還流下にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え酢酸エチルにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、未精製の2-ニトロ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (3.8 g、粗収率100%) を得た。

続いて、未精製の2-ニトロ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (3.8 g) をメタノール (35 ml) に溶解させ、室温にて酸化白金 (300 mg) を添加し、反応系内を水素にて置換した後12時間攪拌した。反応終了後、系内を窒素にて置換した後、セライト濾過により酸化白金を除去し、続いて減圧下にて濃縮することにより、有用中間体である未精製の2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (化合物A) (3.4 g、粗収率100%) を得た。

上記製造方法にて合成した、2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (化合物A) (1.6 g) を無水塩化メチレン (20 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (1.0 ml) および3-(クロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (1.2 ml) を滴下した後、室温にて1時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮し得られた残渣に蒸留水を加え、酢酸エチルを用いて分液抽出を行った。有機層を硫酸ナトリウムで乾燥し

た後、減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (1.7 g、収率63%)を得た。

上記反応にて得られた、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (200 mg) を無水塩化メチレン (2 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (150  $\mu$ l) およびジイソプロパノールアミン (化合物B') (150 mg) を添加した後、同温度にて36時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (200 mg、収率82%)を得た。

続いて、2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド エチルエステル (200 mg) をエタノール (2 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (200  $\mu$ l) を滴下した後、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系カラムクロマトグラフィーにより精製し、有用中間体である3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-(2-ヒドラジノカルボニル-4-ピペリジン-1-イルフェニル) ベンズアミド (200 mg、収率100%)を得た。

上記方法にて製造した、3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-(2-ヒドラジノカルボニル-4-ピペリジン-1-イルフェニル) ベンズアミド (53 mg) を無水トルエン (5 ml) にて溶解させ、室温にて4-クロロ-3-(トリフルオロメチル) ベンズアルデヒド (化合物C) (69 mg) および触媒量の酢酸を滴下した後、90℃にて3時間攪拌した。

反応終了後、放冷し生じた結晶を桐山濾過により分取し、表題の化合物 9.4.2 (15 mg、収率 20%) を得た。また、桐山濾過により得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにより精製することで、表題の化合物 9.4.2 (37 mg、収率 50%) を再度得ることが出来る。(最終工程：全収率 70%)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.31–8.38 (3H, m), 8.00–8.07 (2H, m), 7.86 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.67 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.48 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.38 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.23 (1H, dd,  $J=2.7\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 3.83–3.95 (4H, m), 3.20–3.25 (4H, m), 2.38–2.55 (4H, m), 1.70–1.78 (4H, m), 1.58–1.66 (2H, m), 1.07 (3H, s), 1.06 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 672, 674 ( $M-1$ )

#### 実施例 K

化合物 9.4.3 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[4-(2-ジエチルアミノ-エトキシ)-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法にて製造した 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ヒドロキシフェニル]-ベンズアミド (45 mg) を N,N-ジメチルホルムアミド (10 ml) に溶解させ、室温にて 60%-水素化ナトリウム (4.0 mg) を添加し、同温度にて 10 分間攪拌した。続いて、(2-ブロモエチル) ジエチルアミン・ブロモ酸塩 (44 mg) を添加し 12 時間攪拌した。反応終了後、蒸留水を注加し、酢酸エチルを用いて分液抽出した。得られた有機層を飽和食塩水にて洗浄し、硫酸ナトリウムを用いて乾燥させた。得られた有機層を減圧下にて濃縮し、クロロホルム系のカラムクロマトグラフィーを用いて精製することにより表題の化合物 9.4.3 (7 mg、収率 13%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  10.02 (1H, bs), 8.20–8.25 (1H, m), 7.75–8.00 (3H, m), 7.35–7.50 (2H, m), 7.30 (1H, s), 7.23 (1H, s), 6.96–7.10 (3H, m), 4.25–4.45 (2H, m), 3.70–4.00 (4H, m), 2.30–2.80 (10H, m), 2.20–2.30 (6H, m), 1.00–1.20 (12H, m)

質量分析 (ESI-MS) 630 ( $M-1$ )      654 ( $M+23$ )

### 実施例 L

**化合物 944** 3- { [ピズ- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- (2-オキソ-ピロリジン-1-イル) -フェニル] -ベンズアミド

5-アミノ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド (化合物 A') (910 mg) をメタノール (50 ml) に溶解させ、氷浴下にて塩化チオニル (0.74 ml) を滴下し、加熱還流下にて12時間反応させた。反応終了後、室温にて放冷した後減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製し、5-アミノ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (410 mg、収率42%) を得た。

続いて、5-アミノ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (750 mg) を無水塩化メチレン (30 ml) に溶解させ、室温にてピリジン (360 mg : 無水塩化メチレン 2 ml に溶解) および4-クロロ-ブチリルクロライド (化合物 D) (630 mg : 無水塩化メチレン 2 ml に溶解) を滴下した後、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である5- (4-クロロ-ブチルアミノ) -2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステルを製造した (1.2 g、収率100%)。

続いて、5- (4-クロロ-ブチルアミノ) -2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (50 mg) をN, N-ジメチルホルムアミド (5 ml

1) に溶解させ、室温にてモルホリン (70 mg)、炭酸カリウム (44 mg) をそれぞれ添加し、室温にて3時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-ニトロ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッドメチルエステル (45 mg、収率100%) を製造した。

2-ニトロ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッドメチルエステル (24 mg) をエタノール (5 ml) に溶解させ、室温にて10%パラジウム-炭素 (3 mg) を添加し、反応系内を水素により置換後、同温度にて4時間攪拌した。反応終了後、セライト濾過を行うことにより10%パラジウム-炭素を除去し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-アミノ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッドメチルエステル (化合物A) (10 mg、収率83%) を製造した。

上記製造方法にて得られた、2-アミノ-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッドメチルエステル (化合物A) (10 mg) を無水塩化メチレンに溶解させ、0℃にてピリジン (5 mg: 無水塩化メチレン1 ml に溶解) および3-(クロロメチル)-ベンゾイルクロライド (化合物B) (11 mg: 無水塩化メチレン1 ml に溶解) を滴下し、室温にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッドメチルエステル (14 mg、収率93%) を製造した。

続いて、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5-(2-オキソ-ピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッドメチルエステル (14 mg) を無水塩化メチレン (5 ml) に溶解させ、0℃にてトリエチルアミン (7 m

g : 無水塩化メチレン 2 ml に溶解) およびジイソプロパノールアミン (化合物 B') (10 mg : 無水塩化メチレン 2 ml に溶解) を滴下し、室温にて 24 時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (8.0 mg、収率 47%) を得た。

上記反応にて得られた、2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-(2-オキソピロリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (8.0 mg) をエタノール (5 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (1 ml) を滴下し、同温度にて 1 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮し残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-ヒドラジノカルボニル-4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル]-ベンズアミド (8.0 mg、収率 100%) を得た。

続いて、上記反応にて得られた 3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-ヒドラジノカルボニル-4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル]-ベンズアミド (8.0 mg) を無水トルエン (5 ml) に溶解させ、室温にて 3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物 C) (4.6 mg : 無水トルエン 2 ml に溶解)、および触媒量の酢酸を滴下し、同温度にて 4 時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて中和した後、酢酸エチルを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物 944 (6.5 mg、収率 65%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  12.11 (1H, d,  $J = 8$ .



3 Hz), 10.88 (1H, d,  $J=9.8$  Hz), 8.74 (1H, d.d,  $J=17.1$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 8.20–8.30 (3H, m), 7.95–8.05 (1H, m), 7.28–7.60 (5H, m), 7.08 (1H, d.d,  $J=3.4$  Hz,  $J=8.0$  Hz), 3.75–4.10 (5H, m), 2.40–2.61 (5H, m), 2.25 (3H, s), 2.23 (3H, s), 1.95–2.15 (2H, m), 1.25 (2H, s), 1.11 (6H, d,  $J=6.4$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 598 ( $M-1$ )      622 ( $M+23$ )

化合物 945 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- (2-オキソ-ピロリジン-1-イル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 L とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 945 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  12.33 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 11.94 (1H, bs), 8.71 (1H, d.d,  $J=9.0$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 8.07–8.40 (3H, m), 8.11 (1H, d,  $J=21.0$  Hz), 7.99 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.78 (1H, d.d,  $J=8.3$  Hz,  $J=29.0$  Hz), 7.20–7.50 (4H, m), 3.55–4.20 (6H, m), 2.45–2.74 (4H, m), 2.25–2.42 (2H, m), 1.78–1.87 (2H, m), 1.50–1.72 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 672 ( $M-1$ )

化合物 946 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (4-メトキシー-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- (2-オキソ-ピロリジン-1-イル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 L とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 946 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  12.17 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 12.23 (1H, d,  $J=12.4$  Hz), 8.70 (1H, d.d,  $J=9.3$  Hz,  $J=20.7$  Hz), 8.14–8.27 (3H, m), 7.

9.5–8.01 (1H, m), 7.68–7.74 (2H, m), 7.26–7.46 (3H, m), 6.78–6.82 (2H, m), 3.50–4.20 (9H, m), 2.35–2.63 (6H, m), 1.92–2.05 (2H, m), 1.00–1.30 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 600 (M-1)

化合物 947 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[2-(4-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 L とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 947 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  12.21 (1H, d,  $J=5.4$  Hz), 11.44 (1H, d,  $J=12.4$  Hz), 8.70 (1H, dd,  $J=9.0$  Hz,  $J=26.1$  Hz), 8.20–8.35 (3H, m), 7.96–7.99 (1H, m), 7.72–7.82 (2H, m), 7.38–7.46 (2H, m), 7.25–7.32 (1H, m), 6.93–6.99 (2H, m), 3.50–4.10 (6H, m), 2.35–2.64 (6H, m), 1.87–1.97 (2H, m), 1.07–1.14 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 588 (M-1)

化合物 948 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-オキソピロリジン-1-イル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 L とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 948 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  12.13 (1H, d,  $J=3.0$  Hz), 11.28 (1H, d,  $J=11.4$  Hz), 8.68 (1H, dd,  $J=9.2$  Hz,  $J=20.5$  Hz), 8.16–8.29 (3H, m), 7.94–8.00 (1H, m), 7.60–7.70 (2H, m), 7.25–7.45 (3H, m), 7.06–7.11 (2H, m), 3.52–4.07 (6H, m), 2.20–2.61 (9H, m), 1.90–2.00 (2H, m), 1.09–1.30 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 584 (M-1)

実施例M

化合物 949 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- (2-ヒドロキシ-3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ) -フェニル] -ベンズアミド

2-アミノ-5-ヒドロキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (化合物A) (350mg) を無水塩化メチレン (20ml) に溶解させ、0℃でピリジン (230mg) および3- (クロロメチル) ベンゾイックアシッド (化合物B) (540mg) を滴下し、室温にて10分攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムを用いて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -5-ヒドロキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (280mg、収率42%) を製造した。

続いて、上記反応にて得られた2- (3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ) -5-ヒドロキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (280mg) を無水塩化メチレン (20ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (180mg) およびジイソプロパノールアミン (化合物B') (230mg) を滴下し、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムを用いて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2- (3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -ベンゾイルアミノ) -5-ヒドロキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (58mg、収率16%) を得た。

上記製造方法にて得られた、2- (3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -ベンゾイルアミノ) -5-ヒドロキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (60mg) をN, N-ジメチルホルムアミド

(5 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (58 mg) およびエピプロモヒドリン (58 mg : N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml に溶解) を添加し、同温度にて 12 時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え酢酸エチルを用いて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である 2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-オキシラニルメトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (68 mg、収率 66%) を得た。

上記製造方法にて得られた、2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-オキシラニルメトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (12 mg) を無水塩化メチレン (5 ml) に溶解させ、室温にてピペリジン (6.5 mg : 無水塩化メチレン 1 ml に溶解) および触媒量のイッテルビウム (III) トリフルオロメタンスルフォネートを添加し、同温度にて 12 時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムを用いて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより 2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-(2-ヒドロキシ-3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (10 mg、収率 71%) を得た。

続いて上記製造方法にて得られた、2-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-(2-ヒドロキシ-3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル (13 mg) をエタノール (5 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (1 ml) を滴下し、同温度にて 12 時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて濃縮し残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-ヒドラジノカルボニル-4-(2-ヒドロキシ-3

ーピペリジンー1ーイループロポキシ)ーフェニル]ーベンズアミド (5.8 mg、収率45%)を得た。

上記製造方法にて得られた、3- { [ビスー (2-ヒドロキシープロピル)ーアミノ]ーメチル}ーN- [2-ヒドラジノカルボニルー4- (2-ヒドロキシー3-ピペリジンー1-イループロポキシ)ーフェニル]ーベンズアミド (5.8 mg) を無水トルエン (5 ml) に溶解させ、室温にて3, 4-ジメチルベンズアルデヒド (化合物C) (3 mg : 無水トルエン1 ml に溶解) および触媒量の酢酸を滴下し、同温度にて6時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて中和および酢酸エチルを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルムーメタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物949 (4.0 mg、収率60%)を得た。  
 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.97 (1H, bs), 7.94–8.65 (4H, m), 6.98–7.65 (7H, m), 3.52–4.45 (7H, m), 1.50–2.90 (16H, m), 1.20–1.30 (6H, m), 1.00–1.18 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 672 (M-1)

化合物950 3- { [ビスー (2-ヒドロキシープロピル)ーアミノ]ーメチル}ーN- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ー4- (2-ヒドロキシー3-ピペリジンー1-イループロポキシ)ーフェニル]ーベンズアミド

実施例Mとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物950を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  12.10–12.20 (1H, m), 7.20–8.70 (10H, m), 6.95–7.05 (1H, m), 1.50–4.25 (17H, m), 1.20–1.30 (6H, m), 0.85–1.18 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 746 (M-1)

化合物951 3- { [ビスー (2-ヒドロキシープロピル)ーアミノ]ーメチル}ーN- [4- (3-ジエチルアミノー2-ヒドロキシープロポキシ)ー2-

(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Mとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物951を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  12.02 (1H, bs), 8.58-8.65 (1H, m), 8.47 (1H, s), 8.17-8.24 (1H, m), 7.80-8.00 (1H, m), 7.27-7.60 (5H, m), 6.98-7.10 (2H, m), 1.50-4.12 (23H, m), 1.20-1.28 (6H, m), 1.08-1.16 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 660 (M-1)

化合物952 3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(3-ジエチルアミノ-2-ヒドロキシ-プロポキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Mとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物952を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  12.21 (1H, d,  $J=16.1\text{Hz}$ ), 8.64-8.67 (1H, m), 8.50-8.58 (1H, m), 8.30-8.38 (1H, m), 7.80-8.12 (3H, m), 7.35-7.50 (4H, m), 6.97-7.00 (1H, m), 1.50-4.50 (17H, m), 1.20-1.35 (6H, m), 1.08-1.17 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 734 (M-1)

化合物953 3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-ヒドロキシ-3-モルホリン4-イル-プロポキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Mとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物953を得た。

質量分析 (ESI-MS) 674 (M-1)

化合物954 3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒド

ラジノカルボニル) - 4 - (2-ヒドロキシ-3-モルホリン4-イル-プロポキシ) - フェニル] - ベンズアミド

実施例Mとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物954を得た。

質量分析 (ESI-MS) 748 (M-1)

#### 実施例N

化合物955 N-[3-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-5-メチル-チオフェン-2-イル]-3,4-ジメトキシ-ベンズアミド

メチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート (化合物A) (160 mg) を無水塩化メチレン (5 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (120 mg : 無水塩化メチレン 2 ml に溶解) および 3,4-ジメトキシベンゾイルクロライド (化合物B) (300 mg) を添加し、室温にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムを用いて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより 2-(3,4-ジメトキシ-ベンゾイルアミノ)-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステル (320 mg、収率100%) を得た。

続いて、0℃にてN,N-ジメチルホルムアミド (29 mg) にオキシ塩化リン (100 μl) を滴下し、同温度にて5分間攪拌した。続いて、反応系を80℃まで昇温した後、上記反応にて得られた 2-(3,4-ジメトキシ-ベンゾイルアミノ)-チオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステル (64 mg : N,N-ジメチルホルムアミド 1 ml に溶解) を滴下し、同温度にて2時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム溶液にて中和した後、クロロホルムを用いて分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、未精製の 2-(3,4-ジメトキシ-ベンゾイルアミノ)-5-ホルミルチオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチルエステル (70 mg、粗収率100%) を得た。

上記製造方法にて合成した、未精製の 2-(3,4-ジメトキシ-ベンゾイルアミノ)-5-ホルミルチオフェン-3-カルボキシリックアシッド メチル

エステル (35 mg) をテトラヒドロフラン／N, N-ジメチルホルムアミド = 1 / 1 (10 ml) に溶解させ、室温にて水素化ホウ素ナトリウム (22 mg) を添加し、同温度にて20分間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムを用いて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、未精製の2-(3, 4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-5-ヒドロキシメチルチオフェン-3-カルボキシリクアシッド メチルエステルを得た (35 mg、粗収率100%)。

続いて、上記製造方法にて合成した、未精製の2-(3, 4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-5-ヒドロキシメチルチオフェン-3-カルボキシリクアシッド メチルエステル (未精製35 mg) を無水塩化メチレン (5 ml) に溶解させ、室温にてピリジン (24 mg : 無水塩化メチレン1 ml に溶解) および無水酢酸 (31 mg : 無水塩化メチレン1 ml に溶解) を滴下して、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムを用いて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより有用中間体である5-アセトキシメチル-2-(3, 4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-チオフェン-3-カルボキシリクアシッド メチルエステル (26 mg、3工程収率67%) を製造した。

上記製造方法にて得られた、5-アセトキシメチル-2-(3, 4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-チオフェン-3-カルボキシリクアシッド メチルエステル (26 mg) をエタノール／テトラヒドロフラン = 5 / 2 (7 ml) に溶解させ、室温にて10%パラジウム-炭素 (10 mg) を添加し、反応系内を水素により置換後、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、反応系を窒素により置換した後セライト濾過を行うことにより10%パラジウム-炭素を除去し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより2-(3, 4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-5-メチルチオフェン-3-カルボキシリクアシッド メチルエステル (13 mg、収率59%) を製造した。

続いて、上記製造方法にて合成した2-(3, 4-ジメトキシベンゾイル



アミノ) - 5 - メチルチオフェン - 3 - カルボキシリックアシッド メチルエステル (16 mg) をエタノール (5 ml) に溶解させた後、室温にてヒドラジン (1 ml) を注加し、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、減圧下にて反応系を濃縮し、得られた残渣をクロロホルム - メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、N - (3 - ヒドラジノカルボニル) - 5 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド (8.0 mg、収率50%) を得た。

続いて、N - (3 - ヒドラジノカルボニル) - 5 - メチルチオフェン - 2 - イル) - 3, 4 - ジメトキシベンズアミド (8.0 mg) を無水トルエン (5 ml) に溶解させ、室温にて4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンズアルデヒド (化合物C) (15 mg : 無水トルエン1 ml に溶解) および触媒量の酢酸を滴下し、同温度にて3時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム溶液にて中和した後、酢酸エチルを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム - メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより表題の化合物955 (5.0 mg、収率38%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 12.66 (1H, bs), 9.19 (1H, bs), 8.19 (1H, bs), 8.02 (1H, s), 7.80 - 7.92 (1H, m), 7.62 - 7.65 (2H, m), 7.56 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 6.92 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.97 (3H, s), 3.95 (3H, s), 2.44 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 524 (M-1)

#### 実施例O

**化合物956** N - [3 - (4 - クロロ - 3 - トリフルオロメチルベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - 4 - メチル - 5 - ピペリジン - 1 - イルメチルチオフェン - 2 - イル] - 3 - ジエチルアミノメチルベンズアミド

エチル - 2 - アミノ - 4 - メチルチオフェン - 3 - カルボキシレート (化合物A) (370 mg) を無水塩化メチレン (10 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (240 mg : 無水塩化メチレン2 ml に溶解) および3 - (クロロメチ

ル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (570 mg : 無水塩化メチレン 2 ml に溶解) を滴下し、室温にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を注加した後、クロロホルムを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより 2-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-4-メチルチオフェン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル (670 mg、収率99%) を得た。

続いて、上記製造方法にて合成した 2-(3-ジエチルアミノメチルベンゾイルアミノ)-4-メチルチオフェン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル (700 mg) を無水塩化メチレン (10 ml) に溶解させ、0℃にてトリエチルアミン (425 mg : 無水塩化メチレン 2 ml に溶解) およびジエチルアミン (化合物B') (310 mg : 無水塩化メチレン 2 ml) を滴下し、室温にて2時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を注加した後クロロホルムを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより 2-(3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-4-メチルチオフェン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル (690 mg、収率88%) を得た。

続いて、0℃にてN, N-ジメチルホルムアミド (73 mg) にオキシ塩化リン (200  $\mu$ l) を滴下し、同温度にて5分間攪拌した。反応系を80℃まで昇温した後、上記製造方法にて合成した、2-(3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-4-メチルチオフェン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル (187 mg) を添加し、同温度にて3時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム溶液にて中和した後、クロロホルムを用いて分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフにて精製することにより、有用中間体である、2-(3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-5-ホルミル-4-メチルチオフェン-3

ーカルボキシリックアシッド エチルエステル (110 mg、収率 53%) を製造した。

上記方法にて合成した、2-(3-ジエチルアミノメチルーベンゾイルアミノ)-5-ホルミル-4-メチルチオフエン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル (110 mg) を N, N-ジメチルホルムアミド (10 ml) に溶解させ、室温にて酢酸 (100  $\mu$ l) およびソディウムトリアセトキシボロハイドライド (66 mg) を添加し、同温度にて 1 時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム溶液にて中和および酢酸エチルを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、2-(3-ジエチルアミノメチルーベンゾイルアミノ)-4-メチル-5-ピペリジン-1-イルメチルチオフエン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル (79 mg、収率 64%) を得た。

続いて、2-(3-ジエチルアミノメチルーベンゾイルアミノ)-4-メチル-5-ピペリジン-1-イルメチルチオフエン-3-カルボキシリックアシッド エチルエステル (79 mg) をエタノール (10 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (2 ml) を滴下した後、同温度にて 12 時間反応させた。反応終了後、減圧下にて反応系を濃縮し、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより有用中間体である、3-ジエチルアミノメチルーN-(3-ヒドラジノカルボニル-4-メチル-5-ピペリジン-1-イルメチルチオフエン-2-イル)-ベンズアミド (30 mg、収率 38%) を得た。

続いて、上記製造方法にて得られた 3-ジエチルアミノメチルーN-(3-ヒドラジノカルボニル-4-メチル-5-ピペリジン-1-イルメチルチオフエン-2-イル)-ベンズアミド (15 mg) を無水トルエンに溶解させ、室温にて 4-クロロ-3-(トリフルオロメチル) ベンズアルデヒド (化合物 C) (21 mg: 無水トルエン 1 ml に溶解) および触媒量の酢酸を滴下した後、同温度にて 3 時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム溶液にて中和した後、酢酸エチルを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫

酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物 956 (6.0 mg、収率 29%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.26 (1H, bs), 8.05 (1H, s), 8.00 (1H, s), 7.95 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.88 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.55–7.62 (2H, m), 7.42–7.48 (1H, m), 3.67 (2H, s), 2.48–2.60 (10H, m), 1.24–2.00 (9H, m), 1.07 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 646 ( $M-1$ )

化合物 957 3-ジエチルアミノメチル-N-[3-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メチル-5-ピペリジン-1-イルメチル-チオフェン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 O とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 957 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 8.08 (1H, bs), 7.99 (1H, bs), 7.90 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.74 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.40–7.45 (1H, m), 6.94 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.86 (3H, s), 3.67 (2H, s), 2.40–2.60 (10H, m), 1.25–1.62 (9H, m), 1.06 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 574 ( $M-1$ )      598 ( $M+23$ )

化合物 958 3-{[ビス-(2-ヒドロキシアプロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-ピペリジン-1-イルフェニル]-ベンズアミド

実施例 J とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 958 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.38 (1H, dd,  $J=6.1\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 8.01 (1H, bs), 7.86 (1H, d,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 7.75–7.85 (2H, m), 7.59 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.48 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,

$J = 7.8 \text{ Hz}$ ),  $7.37$  (1H, d,  $J = 2.7 \text{ Hz}$ ),  $7.22$  (1H, dd,  $J = 3.0 \text{ Hz}$ ,  $J = 9.0 \text{ Hz}$ ),  $6.90 - 7.03$  (2H, m),  $3.80 - 3.90$  (7H, m),  $3.22 - 3.30$  (4H, m),  $2.40 - 2.60$  (4H, m),  $1.70 - 1.89$  (4H, m),  $1.62 - 1.64$  (2H, m),  $1.08$  (3H, d,  $J = 6.3 \text{ Hz}$ ),  $1.07$  (3H, d,  $J = 6.1 \text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS)  $600$ ,  $601$  ( $M-1$ )  $622$  ( $M-1+23$ )

### 実施例 P

**化合物 959** 3- { [ビス- (2-ヒドロキシプロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ナフタレン-2-イル] -ベンズアミド

3-アミノナフタレン-2-カルボキシリックアシッド (化合物 A') (1.2 g) を無水塩化メチレン (12 ml) に溶解させ、室温にて 1- (3-ジメチルアミノプロピル) -3-エチルカルボジイミド・塩酸塩 (2.5 g)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール・1水和物 (1.5 g) およびトリエチルアミン (1 ml) を添加した後、同温度にて 12 時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である 3-アミノナフタレン-2-カルボキシリックアシッド メチルエステル (化合物 A) (530 mg、収率 41%) を得た。

上記方法にて製造した、3-アミノナフタレン-2-カルボキシリックアシッドメチルエステル (化合物 A) (530 mg) を無水塩化メチレン (10 ml) に溶解させ、室温にてピリジン (0.5 ml) および 3- (クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (0.6 ml) を滴下した後、同温度にて 30 分間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えクロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、減圧下にて濃縮をおこなうことにより結晶を析出させた。得られた結晶を桐山濾過により分取し、

ヘキサン-エーテル系の溶媒にて洗浄することにより、3-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-ナフタレン-2-カルボキシリックアシッド メチルエステル (870 mg、収率93%) を得た。

続いて、3-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-ナフタレン-2-カルボキシリックアシッド メチルエステル (870 mg) を無水塩化メチレン (15 ml) に溶解させ、室温にてピリジン (400  $\mu$ l) およびジイソプロパノールアミン (化合物B') (1.0 g) を添加した後、同温度にて48時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である3-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-ナフタレン-2-カルボキシリックアシッド メチルエステル (640 mg) を得た。

上記反応にて得られた、3-(3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-ナフタレン-2-カルボキシリックアシッド メチルエステル (640 mg) をエタノール (7 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (1 ml) を滴下した後、同温度にて2時間攪拌した。反応終了後、反応溶液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにより精製することにより、3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)アミノ]-メチル}-N-(3-ヒドラジノカルボニルナフタレン-2-イル)-ベンズアミド (350 mg、収率54%) を得た。

続いて、3-{[ビス-(2-ヒドロキシプロピル)アミノ]-メチル}-N-(3-ヒドラジノカルボニルナフタレン-2-イル)-ベンズアミド (50 mg) を無水トルエン (1 ml) に溶解させ、室温にて3-フルオロベンズアルデヒド (化合物C) (50  $\mu$ l) を滴下した後、120℃にて12時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷した後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物959 (32 mg、収率51%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  12.05 (1H, bs), 11.40–11.55 (1H, m), 8.86 (1H, d,  $J=18.6\text{ Hz}$ ), 8.10–8.40 (3H, m), 7.88 (1H, dd,  $J=7.3\text{ Hz}$ ,  $J=17.8\text{ Hz}$ ), 7.66 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.25–7.50 (5H, m), 7.05–7.15 (2H, m), 6.80–6.95 (1H, m), 4.15–4.25 (2H, m), 3.95–4.05 (2H, m), 3.89 (1H, s), 3.60 (1H, d,  $J=1.4\text{ Hz}$ ), 2.48–2.83 (4H, m), 1.20 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.14 (3H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 555 ( $M-1$ )

化合物 960 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ナフタレン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 960 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  11.90 (1H, bs), 10.90–11.00 (1H, m), 8.85 (1H, bs), 8.30 (1H, d,  $J=3.9\text{ Hz}$ ), 7.86–8.20 (3H, m), 7.52–7.64 (3H, m), 7.28–7.46 (4H, m), 7.06–7.18 (1H, m), 6.88 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.80–3.96 (4H, m), 3.55–3.60 (1H, m), 2.40–2.70 (4H, m), 2.18–2.23 (3H, m), 1.10 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.06 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 551 ( $M-1$ )

化合物 961 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル} -N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ナフタレン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 961 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  11.95–12.05 (1H, m), 10.80–10.95 (1H, m), 8.95–9.02 (1H, m),

8.15–8.32 (3H, m), 7.95–8.05 (1H, m), 7.20–7.80 (8H, m), 6.87 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.60–4.20 (4H, m), 2.28–2.75 (4H, m), 2.00–2.15 (6H, m), 1.10–1.17 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 565 ( $M-1$ )

化合物 962 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ナフタレン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 962 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.96–12.05 (1H, m), 11.71 (1H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 8.80 (1H, s), 8.32 (2H, bs), 8.13 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.57–7.94 (4H, m), 7.25–7.46 (5H, m), 7.08 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 3.50–4.20 (5H, m), 2.30–2.86 (4H, m), 1.13 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.09 (3H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 639, 641, 642 ( $M-1$ )

化合物 963 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ナフタレン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 963 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.95 (1H, bs), 10.86–11.00 (1H, m), 8.80–8.90 (1H, m), 8.05–8.30 (3H, m), 7.85–7.95 (1H, m), 7.60–7.65 (3H, m), 7.22–7.48 (4H, m), 7.06–7.18 (1H, m), 6.59 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 3.50–3.96 (8H, m), 2.40–2.70 (4H, m), 1.10 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.06 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 567 ( $M-1$ )                      591 ( $M+23$ )



化合物 964 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ピリジン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 964 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.55-8.60 (1H, m), 8.29 (1H, s), 8.25 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 8.07 (1H, s), 7.89-7.96 (1H, m), 7.70 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.57 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.40-7.52 (2H, m), 7.32-7.40 (1H, m), 7.13-7.20 (1H, m), 3.60-3.95 (4H, m), 2.35-2.60 (4H, m), 1.08 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.07 (3H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 506, 507, 508 ( $M-1$ )

化合物 965 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ピリジン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 965 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.54-8.59 (1H, m), 8.21-8.28 (2H, m), 8.05-8.09 (1H, m), 7.86-7.95 (1H, m), 7.72 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.62 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, ddd,  $J=1.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.32-7.37 (1H, m), 7.25 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.81-3.93 (4H, m), 2.39-2.60 (4H, m), 2.37 (3H, s), 1.08 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.07 (3H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 502, 503, 504 ( $M-1$ )      526, 527 ( $M+23$ )

化合物 966 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [3- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)

ーピリジン-2-イル]ーベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 966 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.50–8.60 (1H, m), 8.23–8.28 (2H, m), 8.05–8.08 (1H, m), 7.88–7.98 (1H, m), 7.60–7.66 (2H, m), 7.46–7.56 (2H, m), 7.25–7.40 (1H, m), 7.18–7.22 (1H, m), 3.75–3.94 (4H, m), 2.38–2.60 (4H, m), 2.31 (3H, s), 2.30 (3H, s), 1.08 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.07 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 516, 517 ( $M-1$ )      540, 541 ( $M+23$ )

化合物 967 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル)ーアミノ]ーメチル}ーN- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーピリジン-2-イル]ーベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 967 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.70–11.85 (1H, m), 11.61 (1H, s), 8.58 (1H, s), 8.36 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.00–8.10 (2H, m), 7.80–7.90 (1H, m), 7.40–7.55 (4H, m), 6.75–6.85 (1H, m), 3.86–4.10 (4H, m), 2.45–2.75 (4H, m), 1.10 (6H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 592 ( $M-1$ )      614 ( $M+23$ )

化合物 968 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル)ーアミノ]ーメチル}ーN- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)ーピリジン-2-イル]ーベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 968 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.74 (1H, s), 11.00–11.20 (1H, m), 8.40–8.45 (1H, m), 8.22 (1H, d,  $J=12.4\text{ Hz}$ ), 8.06 (1H, s), 7.80–7.90

(3H, m), 7.35–7.50 (3H, m), 6.80–7.00 (3H, m), 3.80–3.90 (7H, m), 2.40–2.75 (4H, m), 1.05–1.14 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 518 (M-1)      542 (M+23)

化合物 969 N-[3-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ナフタレン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 969 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.15 (1H, s), 10.91 (1H, bs), 7.10–8.90 (15H, m), 3.60–3.75 (4H, m), 2.00–2.85 (11H, m)

質量分析 (ESI-MS) 552, 553 (M-1)

化合物 970 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[3-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ナフタレン-2-イル]-ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 970 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.19 (1H, s), 7.00–8.95 (15H, m), 3.63 (2H, s), 3.59 (2H, t,  $J=5.4\text{ Hz}$ ), 2.50–2.65 (10H, m), 2.40 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 548, 549, 550 (M-1)

化合物 971 N-[3-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-ナフタレン-2-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 971 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.19 (1H, s), 7.00–9.00 (14H, m), 3.63 (2H, s), 3.59 (2H, t,  $J=5.4\text{ Hz}$ ), 2.50–2.75 (10H, m), 2.32 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 562, 563 (M-1)

化合物 972 N- [3- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ナフタレン-2-イル] -3- [4- (2-ヒドロキシーエチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 972 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.19 (1H, s), 8.97 (1H, s), 7.20–8.60 (13H, m), 3.64 (2H, s), 3.57–3.63 (2H, m), 2.50–2.60 (10H, m)

質量分析 (ESI-MS) 636, 637 (M-1)

化合物 973 3- [4- (2-ヒドロキシーエチル) -ピペラジン-1-イルメチル] -N- [3- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -ナフタレン-2-イル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 973 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.25 (1H, s), 10.47 (1H, s), 8.88 (1H, s), 8.48 (1H, s), 7.97 (2H, bs), 7.82 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.74 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.63 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.38–7.43 (3H, m), 7.10–7.20 (1H, m), 6.96 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 3.86 (3H, s), 3.62 (2H, s), 3.59 (2H, t,  $J=5.4\text{ Hz}$ ), 2.50–2.60 (10H, m)

質量分析 (ESI-MS) 564, 565 (M-1)

化合物 974 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 974 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.91 (1H, s), 7.95–8.27 (5H, m), 7.00–7.70 (6H, m), 3.82–4.08 (4H, m), 2.40–2.75 (4H, m), 1.10–1.17 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 511, 512 (M-1)      534 (M+2.3)

化合物 975 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-(3-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 975 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.99 (1H, s), 11.28-11.38 (1H, m), 8.36 (1H, s), 7.95-8.20 (4H, m), 7.68-7.73 (1H, m), 7.35-7.45 (1H, m), 7.15-7.34 (2H, m), 6.87-6.97 (2H, m), 4.10-4.20 (1H, m), 3.85-4.00 (3H, m), 3.65-3.75 (1H, m), 2.62-2.85 (1H, m), 2.30-2.58 (4H, m), 2.15 (3H, s), 1.14 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.08 (3H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 507, 508 (M-1)      531 (M+2.3)

化合物 976 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 976 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.99 (1H, s), 7.95-8.30 (4H, m), 7.30-7.70 (4H, m), 7.26 (1H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 7.13 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 3.38-4.05 (4H, m), 2.34-2.70 (7H, m), 1.08-1.15 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 507, 508 (M-1)      531 (M+2.3)

化合物 977 3- { [ビス-(2-ヒドロキシプロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 977 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.98 (1H, s), 11.

12-11.25 (1H, m), 8.30-8.40 (1H, m), 7.96-8.18 (4H, m), 7.70-7.80 (1H, m), 7.20-7.50 (3H, m), 6.75-6.85 (1H, m), 3.65-4.20 (4H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 2.20-2.30 (3H, m), 2.10-2.14 (3H, m), 2.02-2.08 (3H, m), 1.14 (3H, d,  $J=6.1$  Hz), 1.08 (3H, d,  $J=6.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 521, 522 ( $M-1$ )      545 ( $M+23$ )

化合物 978 3- { [ビス-(2-ヒドロキープロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 978 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.85 (1H, d,  $J=5.1$  Hz), 11.65-11.80 (1H, m), 8.28-8.35 (1H, m), 7.98-8.20 (3H, m), 7.65-7.85 (2H, m), 7.02-7.52 (4H, m), 3.60-4.20 (4H, m), 2.46-2.90 (4H, m), 1.14 (3H, d,  $J=6.1$  Hz), 1.09 (3H, d,  $J=6.1$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 595, 597 ( $M-1$ )      619, 621 ( $M+23$ )

化合物 979 3- { [ビス-(2-ヒドロキープロピル)-アミノ]-メチル } -N-[4-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフエン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 979 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  12.03 (1H, d,  $J=10.5$  Hz), 11.16-11.30 (1H, m), 8.30-8.40 (1H, m), 7.95-8.15 (3H, m), 7.75 (1H, d.d,  $J=3.2$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.36-7.44 (3H, m), 7.28-7.32 (1H, m), 6.45-6.57 (2H, m), 3.65-4.20 (7H, m), 2.44-2.84 (4H, m), 1.13 (3H, d,  $J=6.1$  Hz)

H z), 1.07 (3H, d,  $J=6.4$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 523, 524 (M-1)      547 (M+23)

化合物 980 N-[4-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 980 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.26 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.87 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.00-7.54 (8H, m), 3.59-3.66 (4H, m), 2.50-2.75 (10H, m)

質量分析 (ESI-MS) 508, 509 (M-1)      532 (M+23)

化合物 981 3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[4-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 981 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.81 (1H, bs), 11.50 (1H, bs), 8.24 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.87 (2H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.37-7.70 (5H, m), 7.18-7.25 (2H, m), 3.58 (4H, s), 2.37 (3H, s), 2.40-2.55 (10H, m)

質量分析 (ESI-MS) 504, 505 (M-1)      528 (M+23)

化合物 982 N-[4-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシエチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 982 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  8.22-8.28 (1H, m), 7.95 (1H, s), 7.87 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.30-7.56 (6H, m), 7.10-7.20 (1H, m), 3.57 (4H, s), 2.40-2.60 (10H, m), 2.28 (6H, s)

質量分析 (ESI-MS) 518, 519 (M-1) 542 (M+2.3)

化合物 983 N-[4-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 983 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  11.39 (1H, bs), 8.22 (1H, s), 7.82-8.00 (5H, m), 7.40-7.60 (4H, m), 3.55-3.62 (4H, m), 2.45-2.60 (10H, m)

質量分析 (ESI-MS) 592, 594 (M-1) 616 (M+2.3)

化合物 984 3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-N-[4-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 984 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 11.86 (1H, bs), 11.51 (1H, bs), 8.25 (1H, d,  $J=3.4$  Hz), 7.95 (1H, s), 7.87 (2H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.55-7.75 (2H, m), 7.49 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.41 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.20-7.28 (1H, m), 6.85-7.30 (2H, m), 3.83 (3H, s), 3.58 (4H, s), 2.45-2.60 (10H, m)

質量分析 (ESI-MS) 520, 521 (M-1)

化合物 985 3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-フルオロフェニル]-ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 985 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 12.30-12.40 (1H, m), 8.55-8.65 (1H, m), 8.24-8.32 (1H, m), 8.14 (1H, s), 7.92-8.00 (1H, m), 7.56 (1H, s),



7. 39 (1H, dd,  $J=7.3\text{ Hz}$ ,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7. 31 (1H, s), 7. 16–7. 28 (2H, m), 6. 92–7. 02 (1H, m), 6. 76–6. 86 (1H, m), 3. 80–4. 15 (4H, m), 3. 55–3. 65 (1H, m), 2. 40–2. 75 (4H, m), 2. 14 (3H, s), 2. 06 (3H, s), 1. 10 (3H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 1. 06 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 533, 534 (M-1)

化合物 986 2- (3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -ベンゾイルアミノ) -N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-フルオロ-フェニル] -5-フルオロ-ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 986 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 11. 95–12. 05 (1H, m), 11. 16 (1H, bs), 10. 93 (1H, bs), 8. 75–8. 85 (1H, m), 8. 20–8. 40 (1H, m), 7. 20–8. 10 (1H, m), 6. 92–7. 05 (1H, m), 3. 70–3. 95 (4H, m), 2. 35–2. 60 (4H, m), 2. 12–2. 21 (6H, m), 0. 96–1. 02 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 670 (M-1)

化合物 987 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-フルオロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 987 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8. 60–8. 66 (1H, m), 8. 35 (1H, s), 8. 09 (1H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 7. 95 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7. 38–7. 83 (7H, m), 7. 15–7. 28 (1H, m), 3. 80–4. 10 (4H, m), 2. 58–2. 75 (4H, m), 1. 12 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1. 11 (3H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 523, 524 (M-1) 547 (M+23)

化合物 988 2- (3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -ベンゾイルアミノ) -5-フルオロ-N- [4-フルオロ-2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 988 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.52-8.67 (1H, m), 8.32-8.40 (1H, m), 8.27 (1H, s), 7.36-8.08 (11H, m), 7.13-7.20 (1H, m), 3.60-3.95 (4H, m), 2.38-2.57 (4H, m), 1.02-1.10 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 660, 661 (M-1) 684 (M+23)

化合物 989 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-フルオロ-2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 989 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.60-8.67 (1H, m), 8.31 (1H, s), 8.02-8.07 (1H, m), 7.87-7.92 (1H, m), 7.75 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.67 (1H, dd,  $J=2.7\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7.61 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.36-7.43 (1H, m), 7.26 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.65-3.95 (4H, m), 2.40-2.60 (4H, m), 2.38 (3H, s), 1.09 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 1.08 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 519, 520 (M-1) 543 (M+23)

化合物 990 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [4-フルオロ-2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 P とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 990 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.61-8.67 (1H, m),

8. 29 (1H, s), 8. 03–8. 07 (1H, m), 7. 87–7. 92 (1H, m), 7. 81 (2H, d,  $J=8. 5\text{ Hz}$ ), 7. 66 (1H, dd,  $J=2. 7\text{ Hz}$ ,  $J=9. 3\text{ Hz}$ ), 7. 61 (1H, d,  $J=7. 1\text{ Hz}$ ), 7. 50 (1H, dd,  $J=7. 6\text{ Hz}$ ,  $J=7. 6\text{ Hz}$ ), 7. 38–7. 42 (1H, m), 6. 99 (2H, d,  $J=8. 8\text{ Hz}$ ), 3. 82–3. 93 (4H, m), 3. 84 (3H, s), 2. 40–2. 60 (4H, m), 1. 09 (3H, d,  $J=6. 4\text{ Hz}$ ), 1. 08 (3H, d,  $J=6. 1\text{ Hz}$ )  
 質量分析 (ESI-MS) 535, 536, 537 ( $M-1$ )      559 ( $M+23$ )

化合物 991 N-[5-tert-ブチル-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-3-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 991 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8. 15 (1H, s), 7. 99 (1H, s), 7. 88–7. 97 (2H, m), 7. 70 (1H, s), 7. 60 (1H, d,  $J=7. 3\text{ Hz}$ ), 7. 44–7. 55 (2H, m), 7. 20 (1H, d,  $J=7. 8\text{ Hz}$ ), 3. 64–3. 70 (4H, m), 2. 53–2. 70 (10H, m), 2. 32 (3H, s), 2. 31 (3H, s), 1. 50 (9H, s)

質量分析 (ESI-MS) 574, 575, 576 ( $M-1$ )

化合物 992 3-{[ビス-(2-ヒドロキシ-プロピル)-アミノ]-メチル}-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-チオフェン-3-イル]-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 992 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8. 26–8. 34 (1H, m), 7. 15–8. 13 (10H, m), 3. 80–4. 08 (4H, m), 2. 55–2. 70 (4H, m), 1. 13 (3H, d,  $J=6. 1\text{ Hz}$ ), 1. 12 (3H, d,  $J=6. 1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 511, 512, 513 ( $M-1$ )

化合物 993 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 993 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.19–8.35 (2H, m), 8.00–8.09 (3H, m), 7.83–7.94 (2H, m), 7.68 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.58–7.65 (1H, m), 7.47–7.55 (1H, m), 3.65–3.98 (4H, m), 2.45–2.65 (4H, m), 1.03–1.14 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 595, 597, 598 ( $M-1$ )

化合物 995 3-ジエチルアミノメチル-N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -チオフェン-3-イル] -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 995 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 12.38 (1H, bs), 9.08 (1H, s), 8.39 (1H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ ), 7.95 (1H, s), 7.84 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.74 (1H, bs), 7.65 (1H, bs), 7.51 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.30–7.46 (4H, m), 7.02–7.10 (1H, m), 3.59 (2H, s), 2.48 (4H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 0.99 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 451, 452, 453 ( $M-1$ )

化合物 996 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- {4-プロモ-2- [1- (3-フルオロ-フェニル) -エチリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 996 を得た。

質量分析 (ESI-MS) 599 ( $M-1$ )

化合物 997 3- { [ビス- (2-ヒドロキシープロピル) -アミノ] -メチル} -N- {4-プロモ-2- [1- (4-メトキシ-フェニル) -エチリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 997 を得た。

質量分析 (ESI-MS) 609, 611 (M-1)

化合物 998 3- { [ビス- (2-ヒドロキシ-プロピル) -アミノ] -メチル} -N- {4-クロロ-2- [4- (3-ジメチルアミノ-プロポキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 998 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.67-8.70 (1H, m), 8.30 (1H, s), 8.06 (1H, s), 7.88-7.94 (2H, m), 7.79-7.84 (2H, m), 7.59-7.64 (2H, m), 7.47-7.54 (1H, m), 6.96-7.02 (2H, m), 4.08 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.82-3.95 (4H, m), 2.40-2.60 (6H, m), 2.30-2.34 (6H, s), 1.95-2.05 (2H, m), 1.09 (3H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 1.08 (3H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 622 (M-1)

化合物 999 N- {4-クロロ-2- [4- (3-ジメチルアミノ-プロポキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -フェニル} -3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 999 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 11.58 (1H, bs), 8.54 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 8.26 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.86 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.72 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.50-7.56 (2H, m), 7.38-7.45 (2H, m), 6.91 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 4.03 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 3.60 (2H, s), 2.47-2.65 (8H, m), 2.43 (2H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 2.23 (6H, s), 2.22 (3H, s), 1.94 (2H, tt,  $J=6.8\text{ Hz}$ ,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 0.99 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 619, 620 (M-1)

化合物1000 (4- { [5-クロロ-2- (3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンゾイルアミノ) -ベンゾイル] -ヒドラジノメチル} -フェノキシ) -アセティック アシッド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1000を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.62 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.89-8.00 (3H, m), 7.74 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.51-7.65 (3H, m), 6.98 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 4.44 (2H, s), 3.72 (2H, s), 3.21 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.07 (4H, q,  $J=7.3$  Hz), 2.74 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.32 (3H, s), 1.20 (6H, t,  $J=7.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 592, 594 ( $M-1$ ) 618, 619 ( $M+23$ )

化合物1001 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [3- (4-トリフルオロメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1001を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.30 (1H, s), 7.90-8.03 (4H, m), 7.58-7.64 (1H, m), 7.50-7.57 (1H, m), 7.32-7.38 (2H, m), 3.67 (2H, s), 2.88 (4H, bs), 2.72-2.82 (6H, m), 2.58-2.66 (2H, m), 2.29 (3H, s), 1.83-1.95 (4H, m), 1.09 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 628, 629, 630 ( $M-1$ )

化合物1002 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- {3- [4- (2-ヒドロキシ-エトキシ) -ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル] -4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1002 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.22 (1H, s), 7.70–8.00 (4H, m), 7.58–7.69 (1H, m), 7.50–7.57 (1H, m), 7.02 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 4.10 (2H, t,  $J=4.6\text{Hz}$ ), 3.89 (2H, t,  $J=4.8\text{Hz}$ ), 3.67 (2H, s), 2.80–2.90 (4H, m), 2.66–2.78 (6H, m), 2.60 (2H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ ), 2.28 (3H, s), 1.80–1.95 (4H, m), 1.08 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 604, 605, 606 ( $M-1$ )

化合物 1003 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- {3- [1- (3-フルオロフェニル) -エチリデン-ヒドラジノカルボニル] -4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ [b] チオフェン-2-イル} -ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1003 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 7.85–7.98 (2H, m), 7.68–7.80 (2H, m), 7.47–7.62 (2H, m), 7.40–7.47 (1H, m), 7.10–7.20 (1H, m), 3.66 (2H, s), 2.95 (2H, bs), 2.55–2.85 (10H, m), 2.35 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.87–1.93 (4H, m), 1.05 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 576, 577, 578 ( $M-1$ ) 600, 601 ( $M+23$ )

化合物 1004 キノキサリン-2-カルボキシリック アシッド [4-クロロ-2- (3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -アミド

実施例 1) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1004 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz) : 12.65 (1H, s), 12.30 (1H, s), 9.61 (1H, s), 8.75 (1H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 8.47 (1H, s), 8.20–8.33 (2H, m), 8.00

—8.10 (3H, m), 7.79 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.50—7.67 (3H, m), 7.28—7.38 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 446, 448 ( $M-1$ )

化合物1005 キノキサリン—2—カルボキシリック アシッド [4—クロロ—2—(3, 4—ジメチルーベンジリデン—ヒドラジノカルボニル)—フェニル]—アミド

実施例1) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1005を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 12.52 (1H, bs), 9.68 (1H, s), 9.46 (1H, bs), 8.70—8.80 (1H, bs), 8.12—8.20 (2H, m), 7.82—7.88 (3H, m), 7.40—7.70 (3H, m), 7.12 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 2.26 (3H, s), 2.20 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 456, 458 ( $M-1$ )

化合物1006 キノキサリン—2—カルボキシリック アシッド [4—クロロ—2—(4—クロロ—3—トリフルオロメチルーベンジリデン—ヒドラジノカルボニル)—フェニル]—アミド

実施例1) とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1006を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400 MHz) : 12.57 (1H, s), 12.44 (1H, s), 9.61 (1H, s), 8.73 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.51 (1H, s), 8.20—8.32 (3H, m), 7.98—8.14 (4H, m), 7.85 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.79 (1H, d,  $J=9.0$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 530, 532 ( $M-1$ )

化合物1007 N—[4—クロロ—2—(3—フルオロ—ベンジリデン—ヒドラジノカルボニル)—フェニル]—3—(2, 3—ジヒドロキシ—プロピル—スルファニルメチル)—ベンズアミド

実施例8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1007を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.64 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.36 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.94 (1H, d,



$J=2.4\text{ Hz}$ ),  $7.87$  (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ),  $7.71$  (1H, d,  $J=9.5\text{ Hz}$ ),  $7.60-7.66$  (3H, m),  $7.40-7.54$  (2H, m),  $7.15-7.25$  (1H, m),  $3.90$  (2H, s),  $3.70-3.80$  (1H, m),  $3.48-3.60$  (2H, m),  $2.64$  (1H, dd,  $J=5.6\text{ Hz}$ ,  $J=13.7\text{ Hz}$ ),  $2.51$  (1H, dd,  $J=6.8\text{ Hz}$ ,  $J=13.4\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 514, 516 ( $M-1$ )

化合物1008 N-[4-クロロ-2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1008を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{ MHz}$ ):  $8.65$  (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ),  $8.36$  (1H, s),  $7.97$  (1H, s),  $7.93$  (1H, d,  $J=2.5\text{ Hz}$ ),  $7.87$  (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ),  $7.74$  (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ),  $7.62$  (2H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ),  $7.51$  (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ),  $7.27$  (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ),  $3.90$  (2H, s),  $3.70-3.80$  (1H, m),  $3.50-3.61$  (2H, m),  $2.63$  (1H, dd,  $J=5.6\text{ Hz}$ ,  $J=13.6\text{ Hz}$ ),  $2.50$  (1H, dd,  $J=6.8\text{ Hz}$ ,  $13.6\text{ Hz}$ ),  $2.38$  (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 510, 512, 513 ( $M-1$ )

化合物1009 N-[4-クロロ-2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1009を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{ MHz}$ ):  $8.66$  (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ),  $8.31$  (1H, s),  $7.97$  (1H, bs),  $7.93$  (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ),  $7.87$  (1H, bs),  $7.60-7.69$  (3H, m),  $7.48-7.58$  (2H, m),  $7.15-7.25$  (1H, m),  $3.90$

(2H, s), 3.70–3.80 (1H, m), 3.50–3.61 (2H, m), 2.63 (1H, dd,  $J=5.4\text{ Hz}$ ,  $J=13.7\text{ Hz}$ ), 2.50 (1H, dd,  $J=6.8\text{ Hz}$ ,  $J=13.6\text{ Hz}$ ), 2.32 (3H, s), 2.31 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 524, 526, 529 ( $M-1$ )

化合物1010 N-[4-クロロ-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1010を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8.63 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 8.30–8.34 (1H, m), 8.08 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.96 (1H, bs), 7.94 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.85–7.90 (1H, m), 7.70 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.60–7.67 (2H, m), 7.68–7.55 (1H, m), 3.89 (2H, s), 3.70–3.80 (1H, m), 3.48–3.60 (2H, m), 2.64 (1H, dd,  $J=5.6\text{ Hz}$ ,  $J=13.7\text{ Hz}$ ), 2.50 (1H, dd,  $J=7.1\text{ Hz}$ ,  $J=13.7\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 598, 600, 601, 603 ( $M-1$ )

化合物1011 N-[4-クロロ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例8とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1011を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8.66 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.31 (1H, s), 7.95–7.98 (1H, m), 7.92 (1H, d,  $J=2.4\text{ Hz}$ ), 7.86–7.90 (1H, m), 7.81 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.60–7.65 (2H, m), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.00 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.90 (2H, s), 3.85 (3H, s), 3.70–3.80 (1H, m), 3.50–3.61 (2H, m), 2.63 (1H, dd,

$J = 5.6 \text{ Hz}$ ,  $J = 13.6 \text{ Hz}$ ), 2.51 (1H, dd,  $J = 6.8 \text{ Hz}$ ,  $J = 13.6 \text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 529, 530, 531 (M-1)

化合物 1012 N-[4-クロロ-2-(4-トリフルオロメトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 8 とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1012 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.64 (1H, d,  $J = 9.0 \text{ Hz}$ ), 8.39 (1H, s), 7.93-8.01 (4H, m), 7.85-7.90 (1H, m), 7.60-7.67 (2H, m), 7.51 (1H, dd,  $J = 7.7 \text{ Hz}$ ,  $J = 7.7 \text{ Hz}$ ), 7.36 (2H, d,  $J = 8.1 \text{ Hz}$ ), 3.90 (2H, s), 3.70-3.80 (1H, m), 3.50-3.60 (2H, m), 2.63 (1H, dd,  $J = 5.8 \text{ Hz}$ ,  $J = 13.6 \text{ Hz}$ ), 2.51 (1H, dd,  $J = 6.8 \text{ Hz}$ ,  $J = 13.6 \text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 580, 582, 583 (M-1)

#### 実施例 Q

化合物 1013 3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ベンズアミド

3,4-ジヒドロキシ-ベンゾイックアシッド エチルエステル (化合物 A') (2.0 g) をアセトン (20 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (4.3 g) および 1-ブロモ-2-メトキシ-エタン (化合物 D) (5 ml) を添加した後、70℃にて24時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷し、反応系を減圧下にて濃縮した。得られた残渣に蒸留水を加えた後、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより 3,4-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル (3.06 g、収率 93%) を得た。

上記方法にて製造された、3,4-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベ

ンゾイックアシッド エチルエステル (200 mg) を酢酸 (200  $\mu$ l) に溶解させ、0℃にて発煙硝酸 (200  $\mu$ l) を滴下した後、室温にて1時間攪拌した。反応終了後、反応系を0℃に冷却された蒸留水 (500  $\mu$ l) へ滴下し、続いて飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を用いて中和した。さらに、酢酸エチルによる分液抽出を行い、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、有用中間体である4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-2-ニトロベンゾイックアシッド エチルエステル (220 mg、収率96%) を得た。

続いて、上記方法にて製造された、4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-2-ニトロベンゾイックアシッド エチルエステル (3.0 mg) をメタノールに溶解させ、室温にて酸化白金 (250 mg) を加え、反応系内を水素置換した後、1時間攪拌した。反応終了後、反応系内を窒素置換し、セライト濾過により酸化白金を除去した。続いて、得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーにより精製することにより、2-アミノ-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル (化合物A) (2.5 g、収率92%) を得た。

上記方法にて製造した、2-アミノ-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル (化合物A) (2.5 g) を無水塩化メチレン (40 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (1.4 ml) および3-(クロロメチル)-ベンゾイルクロライド (化合物B) (1.3 ml) を滴下し、室温にて30分間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えた後、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮し、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル (2.3 g、収率62%) を得た。

続いて、2-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル (1.1

g) を無水塩化メチレン (20 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (800  $\mu$ l) および 3-メルカプト-1, 2-プロパンジオール (化合物 B') (600  $\mu$ l) を滴下し、同温度にて 36 時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えた後、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮し、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、2-[3-(2, 3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル (970 mg、収率 77%) を得た。

上記方法にて製造した、2-[3-(2, 3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンゾイルアミノ]-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル (970 mg) をエタノール (10 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (1 ml) を滴下した後、同温度にて 36 時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、3-(2, 3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-N-[2-ヒドラジノカルボニル-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ベンズアミド (780 mg、収率 83%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した、3-(2, 3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-N-[2-ヒドラジノカルボニル-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ベンズアミド (55 mg) を無水トルエン (1 ml) に溶解させ、室温にて 3-フルオロベンズアルデヒド (化合物 C) (50  $\mu$ l) を滴下した後、同温度にて 1 時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物 1013 (66 mg、収率 100%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 12.00 (1H, bs), 10.14 (1H, bs), 8.50 (1H, s), 8.16 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.60-7.78 (2H, m), 7.24-

7. 57 (5H, m), 7. 00–7. 10 (1H, m), 4. 20–4. 28 (2H, m), 4. 00–4. 10 (3H, m), 3. 80–3. 88 (3H, m), 3. 75–3. 80 (2H, m), 3. 60–3. 72 (3H, m), 3. 41 (3H, s), 3. 38 (3H, s), 2. 60 (2H, d,  $J=6. 6\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 628, 629 ( $M-1$ )

化合物1014 N-[4, 5-ビス-(2-メトキシエトキシ)-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2, 3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Qとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1014を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz): 12. 06 (1H, bs), 9. 84 (1H, bs), 8. 54 (1H, s), 8. 13 (1H, bs), 7. 90–7. 96 (2H, m), 7. 77 (1H, s), 7. 65–7. 74 (2H, m), 7. 45–7. 55 (3H, m), 7. 18 (1H, d,  $J=7. 8\text{ Hz}$ ), 4. 22–4. 28 (2H, m), 4. 00–4. 14 (3H, m), 3. 80–3. 85 (3H, m), 3. 75–3. 80 (2H, m), 3. 62–3. 70 (3H, m), 3. 41 (3H, s), 3. 40 (3H, s), 2. 58 (2H, d,  $J=6. 4\text{ Hz}$ ), 2. 34 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 624, 625 ( $M-1$ )

化合物1015 3-(2, 3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-N-[2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5-ビス-(2-メトキシエトキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Qとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1015を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz): 12. 08 (1H, bs), 9. 95 (1H, bs), 8. 53 (1H, s), 8. 11 (1H, bs), 7. 93 (1H, d,  $J=7. 6\text{ Hz}$ ), 7. 76–7. 83 (2H, m), 7. 60 (1H, bs), 7. 45–7. 57 (3H, m), 7. 11 (1H, d,  $J=7. 8\text{ Hz}$ ), 4. 23–4. 28 (2H, m), 4. 07–4. 12 (1H, m), 3. 82–3. 90 (3H, m), 3. 75–3. 80 (2H, m), 3.

6.0–3.70 (3H, m), 3.41 (3H, s), 3.39 (3H, s),  
2.59 (2H, d,  $J=6.6$  Hz), 2.29 (2H, d,  $J=7.4$  Hz),  
2.24 (3H, s), 2.23 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 638 (M-1)

化合物 1016 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Qとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1016得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz): 12.07 (1H, s), 10.69 (1H, s), 8.40 (1H, s), 8.15 (1H, s), 8.07 (1H, s), 7.93 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.73–7.77 (1H, m), 7.71 (1H, s), 7.46–7.56 (2H, m), 7.38 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.33 (1H, s), 4.60 (1H, bs), 4.18–4.23 (2H, m), 3.97–4.08 (3H, m), 3.74–3.95 (5H, m), 3.62–3.72 (1H, m), 3.58 (2H, t,  $J=9.0$  Hz), 3.40 (3H, s), 3.37 (3H, s), 2.58–2.72 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 712.715 (M-1)

#### 実施例R

化合物 1017 3-(2,3-ジヒドロキシ-プロピルスルファニルメチル)-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシ-フェニル]-ベンズアミド

5-メトキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド (2.5 g) をN, N-ジメチルホルムアミド (化合物A') (40 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (4.5 g) およびヨウ化メチル (2.5 ml) を添加した後、同温度にて30分間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えた後、酢酸エチルにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮し、得られた残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフ

イーで精製することにより、5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッドメチルエステル (2.7 g、収率100%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッドメチルエステル (2.7 g) をメタノール (20 ml) に溶解させ、室温にて酸化白金 (180 mg) を添加し、反応系内を水素置換した後、同温度にて5時間攪拌した。反応終了後、反応系内を窒素置換した後、セライト濾過により酸化白金を除去した。続いて、得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をヘキサノ-アセトン系のカラムクロマトグラフィーにより精製することにより、2-アミノ-5-メトキシベンゾイックアシッドメチルエステル (化合物A) (2.2 g、収率96%) を得た。

上記方法にて製造した2-アミノ-5-メトキシベンゾイックアシッドメチルエステル (化合物A) (2.2 g) を無水塩化メチレン (40 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (1.5 ml) および3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (2.1 ml) を滴下した後、室温にて15分間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えた後、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮することにより結晶を析出させ、得られた粗結晶を桐山濾過により分取し、エーテルにて洗浄することにより、2-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-5-メトキシベンゾイックアシッドメチルエステル (3.0 g、収率75%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した2-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-5-メトキシベンゾイックアシッドメチルエステル (1.0 g) を無水塩化メチレン (10 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (1 ml) および3-メルカプト-1, 2-プロパンジオール (化合物B') (1 ml) を滴下した後、同温度にて36時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えた後、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮し、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、有用中間体である2-[3-(2, 3-ジヒドロキシプロパンスルファニルメチル)-ベンゾイル



アミノ] - 5 - メトキシーベンゾイックアシッド メチルエステル (1.2 g、収率 100%) を得た。

上記方法にて製造した、2 - [3 - (2, 3 - ジヒドロキシープロパンスルファニルメチル) - ベンゾイルアミノ] - 5 - メトキシベンゾイックアシッド メチルエステル (1.2 g) をエタノール (20 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (1.3 ml) を滴下した後、同温度にて 12 時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、3 - (2, 3 - ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル) - N - (2 - ヒドラジノカルボニル - 4 - メトキシフェニル) ベンズアミド (840 mg、収率 65%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した、3 - (2, 3 - ジヒドロキシープロピルスルファニルメチル) - N - (2 - ヒドラジノカルボニル - 4 - メトキシフェニル) ベンズアミド (61 mg) を無水トルエン (1.5 ml) に溶解させ、室温にて 3 - フルオロベンズアルデヒド (化合物 C) ( $50 \mu\text{l}$ ) を滴下した後、40°C にて 12 時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物 1017 (59 mg、77%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.42 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8.34 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.85 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.70 (1H, d,  $J=10.2$  Hz), 7.58-7.62 (2H, m), 7.40-7.52 (3H, m), 7.12-7.25 (2H, m), 3.90 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.70-3.78 (1H, m), 3.48-3.60 (2H, m), 2.63 (1H, dd,  $J=5.6$  Hz,  $J=13.7$  Hz), 2.50 (1H, dd,  $J=6.8$  Hz,  $J=13.4$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 510, 511 ( $M-1$ )      534 ( $M+23$ )

化合物 1018    3 - (2, 3 - ジヒドロキシープロピルスルファニルメチル) - N - [4 - メトキシ - 2 - (4 - メチル - ベンジリデン - ヒドラジノカルボニル) - フェニル] - ベンズアミド

実施例Rとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1018を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.44 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.32 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.83–7.89 (1H, m), 7.74 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.41 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.19–7.29 (3H, m), 3.90 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.70–3.78 (1H, m), 3.48–3.61 (2H, m), 2.63 (1H, dd,  $J=5.9$  Hz,  $J=13.7$  Hz), 2.50 (1H, dd,  $J=6.8$  Hz,  $J=13.7$  Hz), 2.38 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 506, 507 ( $M-1$ )

化合物1019 3-(2,3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシフェニル]-ベンズアミド

実施例Rとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1019を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.44 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.86 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.66 (1H, s), 7.60 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.54 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.9$  Hz,  $J=7.9$  Hz), 7.41 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.15–7.25 (2H, m), 3.90 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.70–3.80 (1H, m), 3.49–3.60 (2H, m), 2.63 (1H, dd,  $J=5.6$  Hz,  $J=13.7$  Hz), 2.50 (1H, dd,  $J=7.1$  Hz,  $J=13.7$  Hz), 2.31 (3H, s), 2.30 (3H, s)

質量分析 (ESI-MS) 520 ( $M-1$ )

化合物1020 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシフェニル]-3-(2,3-ジヒドロキシプロピルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Rとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1020を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.41 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8.38 (1H, s), 8.32 (1H, bs), 8.05–8.15 (1H, m), 7.94 (1H, bs), 7.83–7.88 (1H, m), 7.69 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.58–7.63 (1H, m), 7.47–7.52 (1H, m), 7.42 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.20–7.25 (1H, m), 3.90 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.75–3.82 (1H, m), 3.45–3.60 (2H, m), 2.60–2.67 (1H, m), 2.45–2.54 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 594, 596, 597 (M-1)

化合物1021 3-(2,3-ジヒドロキシープロピルスルファニルメチル)-N-[4-メトキシ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Rとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1021を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.44 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.95 (1H, bs), 7.86 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.80 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.40 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.21 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.3$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.90 (3H, s), 3.89 (2H, s), 3.85 (3H, s), 3.70–3.80 (1H, m), 3.49–3.60 (2H, m), 2.63 (1H, dd,  $J=5.6$  Hz,  $J=13.7$  Hz), 2.50 (1H, dd,  $J=7.1$  Hz,  $J=13.4$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 522, 523 (M-1)

化合物1022 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシフェニル]-ベンズアミド

実施例Rとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1022を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.42 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.36 (1H, s), 7.14–8.00 (10H, m), 3.90 (3H, s), 3.73 (2H, s), 3.25 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 3.11 (4H, q,  $J=7.2$  Hz), 2.75 (2H, t,  $J=5.9$  Hz), 2.35 (3H, s), 1.23 (6H, t,  $J=7.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 532, 533, 534 ( $M-1$ )

化合物1023 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-メトキシ-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例Rとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1023を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.36–8.42 (2H, m), 8.33 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.96 (1H, s), 7.89 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.69 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.42 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.22 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 3.90 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.70–2.77 (2H, m), 2.53–2.65 (6H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 616, 618, 619 ( $M-1$ )

化合物1024 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[4-メトキシ-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Rとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1024を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.43 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8.30 (1H, s), 7.97 (1H, bs), 7.90 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.78 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.40 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.20 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz)

9 Hz,  $J=9.2$  Hz), 6.99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 3.89 (3H, s), 3.84 (3H, s), 3.68 (2H, s), 2.85–2.92 (2H, m), 2.75 (4H, q,  $J=7.1$  Hz), 2.62 (2H, t,  $J=7.0$  Hz), 2.30 (3H, s), 1.08 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 544, 545, 546 ( $M-1$ )

### 実施例 S

化合物 1025 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル} -N- [2- (3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- (2-メトキシ-エトキシ) -フェニル] -ベンズアミド

5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド (化合物 A') (1.5 g) をメタノール (15 ml) に溶解させ、氷浴下にてチオニルクロライド (1.5 ml) を滴下した後、80℃にて12時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて中和し、酢酸エチルを用いて分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、未精製の5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.1 g、粗収率70%) を得た。

上記方法にて製造した、未精製の5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.1 g) をアセトン (12 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (1.5 g) および1-ブロモ-2-メトキシエタン (化合物 D) (1.5 ml) を添加した後、70℃にて20時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮した後、残渣に蒸留水を加え、酢酸エチルを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、5-メトキシ-エトキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.0 g、収率73%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した5-メトキシ-エトキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.0 g) をメタノール (10 ml) に溶解させ、室温にて酸化白金 (90 mg) を添加し、反応系内を水素置換した後、

同温度にて5時間攪拌した。反応終了後、反応系内を窒素置換し、セライト濾過により酸化白金を除去した。続いて、得られた濾液を減圧下にて濃縮を行い、残渣をヘキサノー酢酸エチル系のカラムクロマトグラフィーにより精製することにより有用中間体である、2-アミノ-5-メトキシ-エトキシベンゾイックアシッド メチルエステル (化合物A) (770 mg、収率83%) を得た。

上記方法にて製造した2-アミノ-5-メトキシ-エトキシベンゾイックアシッド メチルエステル (化合物A) (770 mg) を無水塩化メチレン (10 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (500  $\mu$ l) および3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物B) (600  $\mu$ l) を滴下した後、室温にて3時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えた後、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮することにより結晶を析出させ、得られた粗結晶を桐山濾過により分取、エーテルにて洗浄することにより2-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-5-メトキシ-エトキシベンゾイックアシッド メチルエステル (1.1 g、収率89%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した2-(3-クロロメチルベンゾイルアミノ)-5-メトキシ-エトキシベンゾイックアシッド メチルエステル (1.1 g) を無水塩化メチレン (15 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (1 ml) およびN, N-ジエチル-N'-メチル-エチレンジアミン (化合物B') (900  $\mu$ l) を滴下した後、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、有用中間体である2-(3-{[(2-ジエチルアミノエチル)-メチルアミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.4 g、収率100%) を得た。

上記方法にて製造した、2-(3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチルアミノ]-メチル}-ベンゾイルアミノ)-5-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.4 g) をエタノール (15 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (1.5 ml) を滴下した後、

同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、3- { [ (2-ジメトキシアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2-ヒドラジノカルボニル-4- (2-メトキシ-エトキシ) -フェニル] -ベンズアミド (1.3 g、収率89%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した3- { [ (2-ジメトキシアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2-ヒドラジノカルボニル-4- (2-メトキシ-エトキシ) -フェニル] -ベンズアミド (52 mg) を無水トルエン (1 ml) に溶解させ、室温にて3-フルオロベンズアルデヒド (化合物C) (50  $\mu$ l) を滴下した後、40℃にて3時間攪拌した。反応終了後、室温にて放冷した後クロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物1025 (50 mg、収率78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.43 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.36 (1H, s), 7.99 (1H, s), 7.90-7.95 (1H, m), 7.68-7.76 (2H, m), 7.08-7.64 (6H, m), 4.20-4.25 (2H, m), 3.77-3.82 (2H, m), 3.73 (2H, s), 3.45 (3H, s), 3.18 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.04 (4H, q,  $J=7.2$  Hz), 2.73 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 2.34 (3H, s), 1.20 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 576, 577, 578 ( $M-1$ )

**化合物1026** 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [4- (2-メトキシ-エトキシ) -2- (4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1026を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.43 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.32 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.89-7.94 (1H, m), 7.73 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.43 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.21-7.30 (3H, m), 4.

2.0-4.25 (2H, m), 3.76-3.81 (2H, m), 3.68 (2H, s), 3.45 (3H, s), 2.58-2.90 (8H, m), 2.38 (3H, s), 2.30 (3H, s), 1.07 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)  
 質量分析 (ESI-MS) 572, 573, 574 (M-1)

化合物 1027 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1027 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.41 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8.38 (1H, s), 8.33 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.96 (1H, s), 7.88-7.92 (1H, m), 7.68 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.44 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.24 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 4.20-4.25 (2H, m), 3.76-3.80 (2H, m), 3.67 (2H, s), 3.44 (3H, s), 2.81 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.68 (4H, q,  $J=7.2$  Hz), 2.59 (2H, t,  $J=7.1$  Hz), 2.29 (3H, s), 1.06 (6H, t,  $J=7.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 660, 662, 663 (M-1) 684 (M+23)

化合物 1028 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ベンズアミド  
 実施例 Q とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1028 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.49 (1H, bs), 8.37 (1H, bs), 8.00 (1H, bs), 7.95 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.85-7.90 (1H, m), 7.40-7.76 (5H, m),



7. 12-7. 24 (1H, m), 4. 22-4. 32 (4H, m), 3. 76-3. 86 (4H, m), 3. 72 (2H, s), 3. 46 (3H, s), 3. 46 (3H, s), 3. 00-3. 08 (2H, m), 2. 82-2. 96 (4H, m), 2. 65-2. 73 (2H, m), 2. 33 (3H, s), 1. 12-1. 20 (6H, m)

質量分析 (ESI-MS) 650, 651, 652 (M-1) 672, 675 (M+23)

化合物1029 N-[4, 5-ビス-(2-メトキシエトキシ)-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノエチル)-メチルアミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例Qとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1029を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8. 49 (1H, s), 8. 34 (1H, s), 8. 00 (1H, s), 7. 92-7. 98 (1H, m), 7. 74 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7. 51-7. 65 (3H, m), 7. 27 (2H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 4. 23-4. 33 (4H, m), 3. 77-3. 87 (4H, m), 3. 71 (2H, s), 3. 46 (3H, s), 3. 46 (3H, s), 2. 60-3. 00 (8H, m), 2. 39 (3H, s), 2. 32 (3H, s), 1. 10 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 646, 647, 648 (M-1)

化合物1030 3-{[(2-ジエチルアミノエチル)-メチルアミノ]-メチル}-N-[2-(3, 4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4, 5-ビス-(2-メトキシエトキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Qとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1030を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8. 48 (1H, s), 8. 31 (1H, s), 8. 01 (1H, s), 7. 95 (1H, d,  $J=7.3\text{Hz}$ ), 7. 40-7. 70 (5H, m), 7. 18-7. 23 (1H, m), 4. 23-4. 32 (4H, m), 3. 76-3. 86 (4H, m), 3. 72 (2H, s), 3. 45-3. 80 (6H, m), 2. 95-3. 05 (2H, m), 2.

8.0-2.90 (4H, m), 2.67 (2H, t,  $J=6.7$  Hz), 2.26-2.34 (9H, m), 1.12 (6H, t,  $J=7.3$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 660, 661, 662 ( $M-1$ )

化合物 1031 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例Qとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1031を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 7.40-8.50 (10H, m), 4.23-4.33 (4H, m), 3.77-3.88 (4H, m), 3.74 (2H, s), 3.45-3.48 (6H, m), 2.65-3.30 (8H, m), 2.35 (3H, s), 1.21 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 734, 736, 737 ( $M-1$ )

化合物 1032 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4,5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Qとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1032を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.48 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.01 (1H, s), 7.95 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.79 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.50-7.70 (3H, m), 7.00 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 4.23-4.33 (4H, m), 3.76-3.88 (7H, m), 3.72 (2H, s), 3.45-3.48 (6H, m), 3.05-3.10 (2H, m), 2.90-3.00 (4H, m), 2.65-2.73 (2H, m), 2.33 (3H, s), 1.16 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 662, 663, 664 ( $M-1$ )

化合物 1033 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-{2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-[2-(2-メトキシ-エトキシ)-エトキシ]-フェニル}-ベン

## ズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1033 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 11.36 (1H, bs), 8.48 (1H, bs), 8.21 (1H, s), 7.65–7.93 (6H, m), 7.10–7.38 (5H, m), 4.12 (2H, bs), 3.78 (2H, bs), 3.63–3.67 (4H, m), 3.56–3.62 (2H, m), 3.50–3.55 (2H, m), 3.28 (3H, s), 3.05 (4H, bs), 2.75–2.80 (2H, m), 2.20–2.40 (3H, m), 1.15–1.25 (6H, m).

質量分析 (ESI-MS) 620, 621, 622 ( $M-1$ )

化合物 1034 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル } -N- [4- [2- (2-メトキシ-エトキシ) -エトキシ] -2- (4-メチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1034 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) : 11.37 (1H, bs), 8.49 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.20 (1H, s), 7.84–7.90 (2H, m), 7.80 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.60 (2H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.20–7.46 (3H, m), 6.98–7.20 (3H, m), 4.05–4.10 (2H, m), 3.68–3.74 (2H, m), 3.61–3.65 (2H, m), 3.50–3.55 (4H, m), 3.28 (3H, s), 2.50–2.70 (8H, m), 2.30 (3H, s), 2.17 (3H, s), 0.95–1.04 (6H, m).

質量分析 (ESI-MS) 616, 617, 618 ( $M-1$ )

化合物 1035 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチルーアミノ] -メチル } -N- { 2- (3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- [2- (2-メトキシ-エトキシ) -エトキシ] -フェニル } -ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1035 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) : 11.37 (1H, bs), 8.48 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.19 (1H, s), 7.86 (1H, s), 7.80 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.54 (1H, s), 7.20–7.46 (4H, m), 6.96–7.12 (3H, m), 4.03–4.10 (2H, m), 3.69 (2H, bs), 3.60–3.65 (2H, m), 3.50–3.55 (4H, m), 3.27 (3H, s), 2.47–2.70 (8H, m), 2.21 (6H, s), 2.16 (3H, s), 0.98 (6H, t,  $J=7.0\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 630, 631, 632 (M-1)

化合物1036 N- {2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- [2- (2-メトキシ-エトキシ) -エトキシ] -フェニル} -3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -ベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1036を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.41 (1H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 8.38 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.96 (1H, s), 7.87–7.92 (1H, m), 7.68 (1H, d,  $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 7.44–7.54 (2H, m), 7.24 (1H, dd,  $J=2.9\text{Hz}$ ,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 4.20–4.26 (2H, m), 3.84–3.90 (2H, m), 3.68–3.74 (2H, m), 3.66 (2H, s), 3.55–3.60 (2H, m), 3.37 (3H, s), 2.53–2.75 (8H, m), 2.28 (3H, s), 1.03 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 704, 706, 707 (M-1)

化合物1037 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- {2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- [2- (2-メトキシ-エトキシ) -エトキシ] -フェニル} -ベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1037を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ ,  $400\text{MHz}$ ) : 8.44 (1H, d,  $J=9.3\text{Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 7.96 (1H, bs), 7.87–7.92 (1H, m), 7.78 (2H, d,  $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.6\text{Hz}$ ,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 7.43 (1H, d,  $J=2.9\text{Hz}$ ), 7.22 (1H, dd,  $J=2.9\text{Hz}$ ,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 6.99 (2H, d,  $J=9.0\text{Hz}$ ), 4.21–4.25 (2H, m), 3.85–3.88 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.69–3.72 (2H, m), 3.67 (2H, s), 3.56–3.59 (2H, m), 3.37 (3H, s), 2.55–2.80 (8H, m), 2.28 (3H, s), 1.04 (6H, t,  $J=7.2\text{Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 632, 633, 634 ( $M-1$ )

#### 実施例 T

化合物 1038 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド (化合物 A') (2.0 g) をメタノール (30 ml) に溶解させ、氷浴下にてチオニルクロライド (3.0 ml) を滴下した後、 $75^\circ\text{C}$  にて 96 時間攪拌した。反応終了後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液にて中和した後、酢酸エチルを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、未精製の 5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (2.2 g、粗収率 100%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した、未精製の 5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (2.2 g) をアセトン (15 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (3.0 g) および 1-ブロモ-3-クロロプロパン (化合物 D) (3.1 ml) を添加した後、同温度にて 2 時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮した後、残渣に蒸留水を加えクロロホルムを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリ

ウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、残渣をヘキサン-アセトン系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、5-(3-クロロプロポキシ)-2-ニトロベンゾイックアシッド メチルエステル (2.9 g、収率 96%) を得た。

上記方法にて製造した、5-(3-クロロプロポキシ)-2-ニトロベンゾイックアシッド メチルエステル (2.9 g) をアセトン (30 ml) に溶解させ、室温にて炭酸カリウム (3.0 g) およびピペリジン (化合物 E) (2.0 ml) を添加した後、70℃にて24時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮した後、残渣に蒸留水を加えクロロホルムを用いた分液抽出を行い、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥し、続いて減圧下にて濃縮を行い、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより2-ニトロ-5-(3-ピペリジン-1-イルプロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (2.4 g、収率 69%) を得た。

続いて、上記方法にて製造した、2-ニトロ-5-(3-ピペリジン-1-イルプロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (2.4 g) をメタノール (24 ml) に溶解させ、室温にて酸化白金 (220 mg) を添加し、反応系内を水素置換した後、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、反応系内を窒素置換し、セライト濾過により酸化白金を除去した。続いて、得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにより精製することにより有用中間体である、2-アミノ-5-(3-ピペリジン-1-イルプロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (化合物 A) (1.1 g、収率 50%) を得た。

上記方法にて製造した、2-アミノ-5-(3-ピペリジン-1-イルプロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (化合物 A) (1.1 g) を無水塩化メチレン (12 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (600  $\mu$ l) および3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (化合物 B) (600  $\mu$ l) を滴下した後、室温にて1時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加えた後、クロロホルムにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリ

ウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮し、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.5 g、収率93%)を得た。

続いて、上記方法にて製造した、2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-5-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.5 g) を無水塩化メチレン (11 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (450  $\mu$ l) およびN, N-ジエチル-N'-メチル-エチレンジアミン (化合物B') (480  $\mu$ l) を滴下した後、同温度にて12時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、有用中間体である2-(3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}ベンゾイルアミノ)-5-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (290 mg、収率34%)を得た。

上記方法にて製造した、2-(3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}ベンゾイルアミノ)-5-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (290 mg) をエタノール (4 ml) に溶解させ、室温にてヒドラジン・1水和物 (300  $\mu$ l) を滴下した後、同温度にて6時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-N-[2-ヒドラジノカルボニル-4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル]-ベンズアミド (140 mg、収率49%)を得た。

続いて、上記方法にて製造した、3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-N-[2-ヒドラジノカルボニル-4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル]-ベンズアミド (50 mg) を無水トルエン (1.2 ml) に溶解させ、室温にて4-クロロ-3-(トリフルオロメチル)ベンズアルデヒド (化合物C) (50  $\mu$ l) を滴下した後、同温

度にて12時間攪拌した。反応終了後、反応系を濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、表題の化合物1038 (67mg、収率100%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.40 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.37 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.03 (1H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.95 (1H, s), 7.85-7.94 (1H, m), 7.68 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.56-7.63 (1H, m), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.44 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.20 (1H, dd,  $J=2.7$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 4.08-4.15 (2H, m), 3.62-3.70 (2H, m), 2.45-2.72 (14H, m), 2.27 (3H, s), 1.98-2.07 (2H, m), 1.60-1.70 (4H, m), 1.45-1.54 (2H, m), 1.01 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 727, 728, 730 ( $M-1$ )

化合物1039 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Tとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1039を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.41 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.37 (1H, s), 8.30-8.34 (1H, m), 8.04 (1H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.83-7.94 (2H, m), 7.68 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.50 (1H, dd,  $J=7.8$  Hz,  $J=7.8$  Hz), 7.42 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.22 (1H, dd,  $J=2.7$  Hz,  $J=9.2$  Hz), 4.14 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.86 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.65-2.80 (6H, m), 2.57 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.05-2.15 (2H, m), 1.67-1.75 (4H, m), 1.50-1.60 (2H, m)



質量分析 (ESI-MS) 675, 677, 678 (M-1)

化合物 1040 3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 T とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1040 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.45 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.28 (1H, s), 7.92 (1H, bs), 7.85 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.78 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.39 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 7.18 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 6.98 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 4.11 (2H, t,  $J=5.7$  Hz), 3.86 (2H, s), 3.83 (3H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.54-2.68 (8H, m), 2.00-2.09 (2H, m), 1.62-1.70 (4H, m), 1.47-1.57 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 603, 604, 605 (M-1)

化合物 1041 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 T とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1041 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.45 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8.28 (1H, s), 7.93 (1H, bs), 7.86 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.65 (1H, s), 7.59 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.53 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.41 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.16-7.23 (2H, m), 4.13 (2H, t,  $J=6.1$  Hz), 3.87 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.55-2.73 (8H, m), 2.31 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.00-2.10 (2H, m), 1.65-1.75 (4H, m), 1.50-1.58 (2

H, m)

質量分析 (ESI-MS) 601, 602, 603 (M-1)

化合物1042 3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Tとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1042を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.46 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.32 (1H, s), 7.93 (1H, bs), 7.86 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.73 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.42 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.25 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.22 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.3$  Hz), 4.23 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 3.87 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.83 (2H, t,  $J=5.7$  Hz), 2.55-2.65 (6H, m), 2.38 (3H, s), 1.62-1.70 (4H, m), 1.46-1.55 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 573, 574, 575 (M-1)

化合物1043 N-[2-(3,4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Tとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1043を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.46 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.29 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.86 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.66 (1H, s), 7.60 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.54 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.50 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.43 (1H, d,  $J=3.0$  Hz), 7.17-7.25 (2H, m), 4.23 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 3.87 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.7$  Hz), 2.83 (2H, t,  $J=5.5$  Hz), 2.55-2.65 (6H, m), 2.32 (3H, s),

2. 30 (3H, s), 1. 61–1. 70 (4H, m), 1. 45–1. 55 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 587, 588 (M-1)

化合物1044 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Tとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1044を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8. 44 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 38 (1H, s), 8. 34 (1H, bs), 8. 03–8. 08 (1H, m), 7. 93 (1H, bs), 7. 86 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 69 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 60 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 7. 50 (1H, dd,  $J=7.8$  Hz,  $J=7.8$  Hz), 7. 44 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7. 24 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.3$  Hz), 4. 23 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 3. 86 (2H, s), 3. 68 (2H, t,  $J=7.0$  Hz), 2. 83 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 2. 55–2. 63 (6H, m), 1. 62–1. 70 (4H, m), 1. 45–1. 55 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 661, 663, 664 (M-1)

化合物1045 3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Tとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1045を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8. 47 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8. 30 (1H, s), 7. 93 (1H, bs), 7. 86 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 7. 80 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7. 60 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 7. 50 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7. 42 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7. 22 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 6. 99 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 4. 23

(2H, t,  $J=5.6$  Hz), 3.87 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.82 (2H, t,  $J=5.6$  Hz), 2.55–2.63 (6H, m), 1.62–1.70 (4H, m), 1.45–1.55 (2H, m)

質量分析 (ESI-MS) 589, 590 (M-1)

化合物 1046 N-[4-シクロヘキシルメトキシ-2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1046 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.41 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 7.97 (1H, s), 7.88–7.93 (1H, m), 7.68–7.78 (1H, m), 7.30–7.64 (5H, m), 7.08–7.22 (2H, m), 3.88 (2H, d,  $J=6.1$  Hz), 3.69 (2H, s), 2.80–2.93 (2H, m), 2.68–2.80 (4H, m), 2.55–2.65 (2H, m), 2.30 (3H, s), 1.68–1.95 (5H, m), 1.10–1.42 (6H, m), 1.08 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 614, 615, 616 (M-1) 638 (M+23)

化合物 1047 N-[4-シクロヘキシルメトキシ-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1047 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.41 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.32 (1H, s), 7.96 (1H, bs), 7.88–7.92 (1H, m), 7.73 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.52 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.39 (1H, d,  $J=2.8$  Hz), 7.26 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.19 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 3.88

(2H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.68 (2H, s), 2.55–2.85 (8H, m), 2.38 (3H, s), 2.29 (3H, s), 1.70–1.95 (5H, m), 1.10–1.42 (6H, m), 1.05 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 610, 611, 612 ( $M-1$ )

化合物1048 N-[4-シクロヘキシルメトキシ-2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1048を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8.42 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 8.28 (1H, s), 7.96 (1H, bs), 7.88–7.93 (1H, m), 7.64 (1H, s), 7.58 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.49–7.55 (2H, m), 7.39 (1H, d,  $J=2.9\text{ Hz}$ ), 7.16–7.23 (2H, m), 3.87 (2H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3.67 (2H, s), 2.55–2.80 (8H, m), 2.31 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s), 1.70–1.95 (5H, m), 1.10–1.42 (6H, m), 1.04 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 624, 625, 626 ( $M-1$ ) 670, 671 ( $M+23\times 2$ )

化合物1049 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-シクロヘキシルメトキシ-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1049を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz): 8.30–8.42 (2H, m), 8.03 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.96 (1H, s), 7.87–7.92 (1H, m), 7.69 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.48–7.54 (2H, m), 7.41 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.20 (1H, dd,  $J=2.7\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ),

3. 88 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3. 67 (2H, s), 2. 54-2. 78 (8H, m), 2. 28 (3H, s), 1. 70-1. 95 (5H, m), 1. 08-1. 42 (6H, m), 1. 04 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 698, 700, 701 (M-1)

化合物 1050 N-[4-シクロヘキシルメトキシ-2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1050 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8. 42 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8. 29 (1H, s), 7. 96 (1H, bs), 7. 87-7. 93 (1H, m), 7. 78 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7. 59 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7. 51 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7. 38 (1H, d,  $J=3.0\text{ Hz}$ ), 7. 18 (1H, dd,  $J=3.0\text{ Hz}$ ,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 6. 99 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3. 87 (2H, d,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 3. 84 (3H, s), 3. 67 (2H, s), 2. 54-2. 80 (8H, m), 2. 28 (3H, s), 1. 70-1. 95 (5H, m), 1. 10-1. 42 (6H, m), 1. 03 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 626, 627, 628 (M-1) 650 (M+23)

化合物 1051 N-[2-(3-フルオロベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-フルオロブトキシ)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1051 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8. 43 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8. 34 (1H, s), 7. 93 (1H, s), 7. 86 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7. 70 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 7. 59 (2H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7. 40-7. 52 (3H, m), 7. 13-7. 25 (2H, m), 4. 55-4. 60 (1H, m), 4. 46 (1H, t,  $J=5.$

7 Hz), 4.13 (2H, t,  $J=5.9$  Hz), 3.87 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.58 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 1.80–1.95 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 540, 541 ( $M-1$ )      564 ( $M+23$ )

化合物 1052 N-[4-(4-フルオロブトキシ)-2-(4-メチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1052 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.45 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.31 (1H, s), 7.93 (1H, bs), 7.86 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.73 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.59 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.6$  Hz,  $J=7.6$  Hz), 7.42 (1H, d,  $J=2.9$  Hz), 7.26 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.21 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.3$  Hz), 4.55–4.60 (1H, m), 4.46 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 4.13 (2H, t,  $J=6.0$  Hz), 3.87 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.57 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.38 (3H, s), 1.80–1.96 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 536, 537 ( $M-1$ )

化合物 1053 N-[2-(3,4-ジメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-フルオロブトキシ)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1053 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz): 8.45 (1H, d,  $J=9.3$  Hz), 8.28 (1H, s), 7.93 (1H, s), 7.86 (1H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.65 (1H, s), 7.59 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.53 (1H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.41 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.17–7.24 (2H, m), 4.55–4.60 (1H, m), 4.46 (1H,

t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 4.12 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 3.87 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.57 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.31 (3H, s), 2.30 (3H, s), 1.83–1.95 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 550, 551 ( $M-1$ )

化合物 1054 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-フルオロ-ブトキシ)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1054 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.42 (1H, d,  $J=9.2\text{ Hz}$ ), 8.37 (1H, s), 8.32 (1H, s), 8.01–8.05 (1H, m), 7.92 (1H, s), 7.85 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.67 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.42 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.22 (1H, dd,  $J=2.7\text{ Hz}$ ,  $J=9.2\text{ Hz}$ ), 4.55–4.60 (1H, m), 4.46 (1H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 4.12 (2H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.57 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.80–1.95 (4H, m)

質量分析 (ESI-MS) 624, 626, 627 ( $M-1$ )

化合物 1055 N-[4-(4-フルオロ-ブトキシ)-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1055 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 6.95–8.60 (12H, m), 4.55–4.62 (1H, m), 4.46 (1H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 4.12 (2H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 3.83–3.88 (3H, m), 3.79 (2H, s), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.57 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 1.80–1.95 (4H, m)



質量分析 (ESI-MS) 552, 553 (M-1)

化合物 1056 3- { [ビス-(2-ジエチルアミノ-エチル)-アミノ]-  
メチル} -N-[3-(4-メチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-  
4, 5, 6, 7-テトラヒドロ-ベンゾ [b] チオフェン-2-イル] -ベンズ  
アミド

実施例 B とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1056 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  0.98 (12H, t,  $J=7.1$  Hz), 1.92 (4H, m), 2.40 (3H, s), 2.45-2.65 (16H, m), 2.76 (2H, m), 2.89 (2H, m), 3.72 (2H, s), 7.24 (2H, m), 7.43 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.60 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.69 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.92 (1H, m), 8.00 (1H, s), 8.08 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 644 (M-1)

化合物 1057 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-  
メチル} -N-[2-(3-フルオロ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-  
4-(4-フルオロ-ブトキシ)-フェニル] -ベンズアミド

実施例 S とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1057 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.41 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.34 (1H, s), 7.88-7.98 (2H, m), 7.40-7.78 (6H, m), 7.14-7.26 (2H, m), 4.55-4.60 (1H, m), 4.46 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 4.13 (2H, t,  $J=5.9$  Hz), 3.68 (2H, s), 2.81 (2H, t,  $J=6.8$  Hz), 2.68 (4H, q,  $J=7.1$  Hz), 2.60 (2H, t,  $J=7.0$  Hz), 2.29 (3H, s), 1.83-1.97 (4H, m), 1.06 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 592, 593, 594 (M-1)          638 (M + 2 × 23)

化合物 1058 3- { [(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]

ーメチル}ーNー[4ー(4ーフルオロブトキシ)ー2ー(4ーメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ーフェニル]ーベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1058を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.42 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.32 (1H, s), 7.95 (1H, s), 7.86–7.92 (1H, m), 7.71 (2H, d,  $J=8.1$  Hz), 7.58 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.51 (1H, dd,  $J=7.7$  Hz,  $J=7.7$  Hz), 7.41 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.25 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.19 (1H, dd,  $J=2.9$  Hz,  $J=9.0$  Hz), 4.55–4.60 (1H, m), 4.45 (1H, t,  $J=5.6$  Hz), 4.11 (2H, t,  $J=5.7$  Hz), 3.66 (2H, s), 2.72–2.79 (2H, m), 2.54–2.68 (6H, m), 2.37 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.80–1.95 (4H, m), 1.04 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 588, 589, 590 ( $M-1$ )      634, 635 ( $M+2\times 23$ )

化合物1059 3ー{ [(2ージエチルアミノーエチル)ーメチルーアミノ]ーメチル}ーNー[2ー(3, 4ージメチルーベンジリデンーヒドラジノカルボニル)ー4ー(4ーフルオロブトキシ)ーフェニル]ーベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1059を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) : 8.43 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.28 (1H, s), 7.96 (1H, bs), 7.88–7.92 (1H, m), 7.63 (1H, s), 7.48–7.62 (3H, m), 7.40 (1H, d,  $J=2.7$  Hz), 7.17–7.23 (2H, m), 4.55–4.60 (1H, m), 4.45 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 4.12 (2H, t,  $J=5.9$  Hz), 3.67 (2H, s), 2.72–2.80 (2H, m), 2.55–2.68 (6H, m), 2.30 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.28 (3H, s), 1.80–1.95 (4H, m), 1.03 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 602, 603 (M-1)      642, 648 (M + 2 × 23)

化合物1060 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-フルオロ-ブトキシ)-フェニル]-3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-ベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1060を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.36-8.42 (2H, m), 8.31 (1H, s), 7.98-8.03 (1H, m), 7.95 (1H, s), 7.86-7.91 (1H, m), 7.67 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.51 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.42 (1H, d,  $J=2.9\text{ Hz}$ ), 7.20 (1H, dd,  $J=2.9\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 4.55-4.60 (1H, m), 4.45 (1H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 4.12 (2H, t,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 3.66 (2H, s), 2.54-2.78 (8H, m), 2.27 (3H, s), 1.80-1.95 (4H, m), 1.03 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 676, 677, 679 (M-1)

化合物1061 3-{[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-メチル}-N-[4-(4-フルオロ-ブトキシ)-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例Sとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1061を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.43 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 8.29 (1H, s), 7.95 (1H, bs), 7.87-7.92 (1H, m), 7.77 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.56-7.61 (1H, m), 7.50 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.40 (1H, d,  $J=2.9\text{ Hz}$ ), 7.19 (1H, dd,  $J=2.7\text{ Hz}$ ,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 6.97 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 4.55-4.59 (1H, m), 4.45 (1H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 4.11 (2H, t,

$J=6.0\text{ Hz}$ ), 3.83 (3H, s), 3.66 (2H, s), 2.54–2.77 (8H, m), 2.28 (3H, s), 1.80–1.97 (4H, m), 1.03 (6H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 604, 605, 606 ( $M-1$ ) 606 ( $M+1$ ) 628, 629 ( $M+23$ )

化合物 1062 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1062 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.67 (2H, m), 2.00 (2H, m), 2.57 (2H, m), 2.99 (2H, m), 3.68 (4H, m), 3.80 (1H, m), 3.86 (2H, s), 7.25 (1H, m), 7.41 (1H, d,  $J=3.0\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, m), 7.59 (1H, m), 7.69 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.85 (1H, m), 7.92 (1H, m), 8.05 (1H, m), 8.34 (2H, m), 8.38 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 633 ( $M-1$ )

化合物 1063 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1063 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.39 (2H, m), 1.63 (1H, m), 1.88 (2H, m), 2.57 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.76 (2H, m), 3.47 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 3.81 (2H, m), 3.86 (2H, s), 7.24 (1H, dd,  $J=9.2\text{ Hz}$ ,  $J=2.8\text{ Hz}$ ), 7.39 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=$

7. 7 Hz), 7. 58 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 67 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 84 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7. 91 (1H, s), 8. 03 (1H, m), 8. 33 (2H, m), 8. 37 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 647 (M-1)

化合物 1064 N-[2-(3, 4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-モロフォリン-4-イル-フェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1064 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2. 30 (3H, s), 2. 31 (3H, s), 2. 57 (2H, m), 3. 24 (4H, m), 3. 68 (2H, m), 3. 87 (6H, m), 7. 21 (2H, m), 7. 38 (1H, s), 7. 45-7. 62 (3H, m), 7. 66 (1H, m), 7. 83-7. 96 (2H, m), 8. 28 (1H, s), 8. 40 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 545 (M-1)

化合物 1065 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-モロフォリン-4-イル-フェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1065 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400 MHz) :  $\delta$  2. 50 (2H, m), 3. 20 (4H, m), 3. 54 (2H, m), 3. 78 (4H, m), 3. 84 (2H, s), 7. 24 (1H, d,  $J=8.1$  Hz), 7. 32 (1H, s), 7. 53 (2H, m), 7. 75-7. 84 (2H, m), 7. 87 (1H, s), 8. 05 (1H, d,  $J=7.8$  Hz), 8. 20 (1H, s), 8. 25 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8. 48 (1H, s), 11. 25 (1H, bs), 12. 24 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 619 (M-1)

化合物 1066 3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-モロフォリン-4-イル-フェニル]-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1066を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  2.57 (2H, m), 3.30 (4H, m), 3.68 (2H, m), 3.86 (9H, m), 7.00 (2H, m), 7.24 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.49 (1H, m), 7.60 (1H, m), 7.75–7.95 (4H, m), 8.29 (1H, s), 8.42 (1H, m)

質量分析 (ESI-MS) 547 (M-1)

化合物1067 N-[4-[1, 4'] ビピペラジニル-1'-イル-2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1067を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400MHz) :  $\delta$  1.60 (2H, m), 1.77 (6H, m), 2.11 (2H, m), 2.57 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.75–3.02 (7H, m), 3.68 (2H, t,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 3.86 (2H, s), 3.93 (2H, m), 7.26 (1H, m), 7.40 (1H, m), 7.49 (1H, m), 7.59 (1H, m), 7.68 (1H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.84 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, s), 8.04 (1H, d,  $J=9.3\text{ Hz}$ ), 8.30–8.40 (3H, m),

質量分析 (ESI-MS) 700 (M-1)

化合物1068 N-[4-[1, 4'] ビピペラジニル-1'-イル-2-(4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1068を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ , 400MHz) :  $\delta$  1.39 (2H, m), 1.45–1.65 (6H, m), 1.84 (2H, m), 2.50 (7H, m), 2.70 (2H, m), 3.54 (2H, m), 3.83 (7H, m), 4.78 (1H, t,  $J=5.6\text{ Hz}$ ), 7.02 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.

1.9 (1H, m), 7.31 (1H, m), 7.53 (2H, m), 7.70 (2H, d,  $J=7.8$  Hz), 7.76 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.86 (1H, s), 8.31 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 8.39 (1H, s), 11.67 (1H, s), 11.88 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 628 (M-1)

化合物 1069 N-[2-(3,4-ジメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-メチルーピペリジン-1-イル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1069 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz):  $\delta$  0.97 (3H, d,  $J=6.6$  Hz), 1.27 (2H, m), 1.53 (1H, m), 1.74 (2H, m), 2.27 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.50 (2H, m), 2.70 (2H, m), 3.54 (2H, m), 3.75 (2H, m), 3.85 (2H, s), 4.77 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 7.21 (2H, m), 7.31 (1H, m), 7.45 (1H, d,  $J=7.6$  Hz), 7.52 (3H, m), 7.76 (1H, d,  $J=7.3$  Hz), 7.87 (1H, s), 8.29 (1H, m), 8.37 (1H, s), 11.41 (1H, s), 11.90 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 557 (M-1)

化合物 1070 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルーベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-メチルーピペリジン-1-イル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシ-エチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1070 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ , 400 MHz):  $\delta$  0.96 (3H, d,  $J=6.3$  Hz), 1.27 (2H, m), 1.53 (1H, m), 1.74 (2H, m), 2.50 (2H, m), 2.70 (2H, m), 3.54 (2H, m), 3.74 (2H, m), 3.84 (2H, s), 4.83 (1H, m), 7.19 (1H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.33 (1H, s), 7.52 (2H,

m), 7.79 (2H, m), 7.86 (1H, s), 8.04 (1H, d,  $J = 7.6 \text{ Hz}$ ), 8.23 (2H, m), 8.49 (1H, s), 12.24 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 631 (M-1)

化合物 1071 3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-N-[2-(4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-メチルピペリジイン-1-イル)-フェニル]-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1071 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  1.01 (3H, d,  $J = 6.1 \text{ Hz}$ ), 1.37 (2H, m), 1.55 (1H, m), 1.80 (2H, m), 2.57 (2H, t,  $J = 6.7 \text{ Hz}$ ), 2.76 (2H, m), 3.68 (2H, m), 3.76 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.86 (2H, s), 6.99 (2H, d,  $J = 8.8 \text{ Hz}$ ), 7.22 (1H, m), 7.38 (1H, m), 7.49 (1H, m), 7.58 (1H, m), 7.79 (2H, d,  $J = 8.5 \text{ Hz}$ ), 7.85 (1H, d,  $J = 7.6 \text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, s), 8.30 (1H, s), 8.36 (1H, d,  $J = 9.3 \text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 559 (M-1)

化合物 1072 N-[2-(4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンジリデン-ヒドラジノカルボニル)-4-(4-メチルピペラジイン-1-イル)-フェニル]-3-(2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル)-ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1072 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz):  $\delta$  2.44 (3H, m), 2.56 (2H, m), 2.74 (4H, m), 3.30 (4H, m), 3.66 (2H, m), 3.85 (2H, m), 7.26 (1H, m), 7.40 (1H, s), 7.49 (1H, m), 7.58 (1H, m), 7.68 (1H, m), 7.83 (1H, m), 7.91 (1H, s), 8.02 (1H, m), 8.35 (3H, m)



質量分析 (ESI-MS) 632 (M-1)

化合物 1073 3- (2-ヒドロキシーエチルスルファニルメチル) -N-  
[2- (4-メトキシベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4- (4-メ  
チル-ピペラジン-1-イル) -フェニル] -ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1073 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) :  $\delta$  2.34 (3H, s), 2.57 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 2.66 (4H, m), 3.31 (4H, m), 3.68 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 3.84 (3H, s), 3.86 (2H, s), 6.99 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.24 (1H, dd,  $J=9.1\text{ Hz}$ ,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 7.38 (1H, d,  $J=2.9\text{ Hz}$ ), 7.49 (1H, d,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.59 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.79 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.85 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.92 (1H, s), 8.29 (1H, s), 8.40 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ )

質量分析 (ESI-MS) 560 (M-1)

化合物 1074 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) -メチル-アミノ] -メチル} -N- [2- (3, 4-ジメチル-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) -4-モロフォリン-4-イル-フェニル] -ベンズアミド

実施例 F とほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物 1074 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz) :  $\delta$  1.04 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.28 (9H, m), 2.59 (6H, m), 2.68 (2H, m), 2.85 (4H, m), 3.41 (4H, m), 3.64 (2H, s), 6.83 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 6.97 (1H, s), 7.18 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.47 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.56 (2H, m), 7.69 (1H, s), 7.89 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 8.00 (1H, s), 8.09 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.55 (1H, s), 11.22 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 597 (M-1)

化合物 1075 N- [2- (4-クロロ-3-トリフルオロメチル-ベンジリ

デンーヒドラジノカルボニル) - 4-モロフォリン-4-イル-フェニル] - 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) - メチル-アミノ] - メチル} - ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1075を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.03 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.28 (3H, s), 2.57 (6H, m), 2.66 (2H, m), 2.80 (4H, m), 3.34 (4H, m), 3.65 (2H, s), 6.80 (1H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 6.89 (1H, s), 7.50 (1H, m), 7.60 (2H, m), 7.89 (1H, d,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, m), 8.03 (1H, s), 8.08 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.13 (1H, s), 8.66 (1H, s), 11.08 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 671 ( $M-1$ )

化合物1076 3- { [ (2-ジエチルアミノ-エチル) - メチル-アミノ] - メチル} - N- [2- (4-メトキシ-ベンジリデン-ヒドラジノカルボニル) - 4-モロフォリン-4-イル-フェニル] - ベンズアミド

実施例Fとほぼ同様な方法を用いて、表題の化合物1076を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , 400MHz) :  $\delta$  1.06 (6H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 2.25 (3H, s), 2.62 (6H, m), 2.72 (2H, m), 2.91 (4H, m), 3.46 (4H, m), 3.62 (2H, s), 3.82 (3H, s), 6.84-6.92 (3H, m), 7.07 (1H, s), 7.44 (1H, dd,  $J=7.7\text{ Hz}$ ,  $J=7.7\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, m), 7.75 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.88 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.97 (1H, s), 8.17 (1H, d,  $J=9.0\text{ Hz}$ ), 8.57 (1H, s), 11.34 (1H, s)

質量分析 (ESI-MS) 599 ( $M-1$ )

#### 実施例U

化合物1077 N-ベンゾイルオキシ-5-クロロ-2- (3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ) - ベンズアミド

2-アミノ-5-クロロ-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.5

g) を無水塩化メチレン (25 ml) に溶解させ、0℃にてピリジン (1.4 ml) および 3-(クロロメチル) ベンゾイルクロライド (1.4 ml) を滴下した後、室温にて30分間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え、クロロホルムにて分液抽出を行った。続いて、得られた有機層を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮し結晶を析出させた。析出した結晶を桐山ロータにて分取し、エーテルにて洗浄することにより、有用中間体である、5-クロロ-2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (2.4 g、収率90%) を得た。

上記方法にて製造された、5-クロロ-2-(3-クロロメチル-ベンゾイルアミノ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (2.4 g) を、無水塩化メチレン (30 ml) に溶解させ、室温にてトリエチルアミン (1.5 ml) およびジエチルアミン (2.0 ml) を滴下した後、同温度にて48時間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、有用中間体である5-クロロ-2-(3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.9 g、収率71%) を得た。

続いて、上記方法にて製造された、5-クロロ-2-(3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル (1.9 g) をテトラヒドロフラン/蒸留水=4/1 (20 ml) に溶解させ、室温にて水酸化リチウム・1水和物 (420 mg) を添加した後、同温度にて2時間30分間攪拌した。反応終了後、反応系を減圧下にて濃縮し、残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーにて精製することにより、5-クロロ-2-(3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-ベンゾイックアシッド (1.0 g、収率56%) を得た。

上記方法にて製造された、5-クロロ-2-(3-ジエチルアミノメチル-ベンゾイルアミノ)-ベンゾイックアシッド (50 mg) をN, N-ジメチルホルムアミド (1.0 ml) に溶解させ、室温にて1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド・塩酸塩 (38 mg)、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール・1水和物 (28 mg)、トリエチルアミン (50  $\mu$ l) および

オーベンジルーヒドロキシルアミン・塩酸塩 (40 mg) を添加した後、同温度にて24時間攪拌した。反応終了後、室温にて蒸留水を加え酢酸エチルにて分液抽出し、有機層を飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧下にて濃縮を行い、得られた残渣をクロロホルム-メタノール系のカラムクロマトグラフィーで精製することにより、表題の化合物 1077 (29 mg、収率 45%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CD}_3\text{OD}$ , 400 MHz) : 8.55 (1H, d,  $J=9.0$  Hz), 7.98 (1H, s), 7.87–7.91 (1H, m), 7.61–7.65 (2H, m), 7.40–7.56 (4H, m), 7.23–7.38 (3H, m), 4.99 (2H, s), 3.89 (2H, s), 2.73 (4H, q,  $J=7.2$  Hz), 1.15 (6H, t,  $J=7.2$  Hz)

質量分析 (ESI-MS) 463, 465, 466 ( $M-1$ )      465, 467 ( $M+1$ )      489 ( $M+23$ )

化合物 1～1076 の原料化合物を示すと表 1 の通りである。表中化合物 A、B、C、および B' は実施例 1～11 および実施例 A～T 並びにスキーム 1 および 2 において示された化合物に対応する。

表 1

	A	B	C	B'
化合物1	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	トランス-シンナムア ルデヒド	
化合物2	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物3	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物4	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	o-メトキシベンズアル デヒド	
化合物5	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-メトキシベンズア ルデヒド	
化合物6	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 5-ジtert-ブチル -4-ヒドロキシベン ズアルデヒド	
化合物7	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	アルファー-メチルシン ナムアルデヒド	
化合物8	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 5-ジトリフルオロ メチルベンズアルデヒ ド	
化合物9	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-シアノベンズアル デヒド	
化合物10	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-ブロムベンズアル デヒド	
化合物11	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	バニリン	
化合物12	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4, 5-トリメトキシ ベンズアルデヒド	
化合物13	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	トランス-シンナムア ルデヒド	
化合物14	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-ブロムベンズアル デヒド	

	A	B	C	B'
化合物15	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物16	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物17	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	ベンズアルデヒド	
化合物18	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物19	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物20	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物21	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	フルフラール	
化合物22	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	5-メチルフルフラール	
化合物23	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-チオフェンカルボ キシアルデヒド	
化合物24	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-チオフェンカルボ キシアルデヒド	
化合物25	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2, 4-ジヒドロキシベ ンズアルデヒド	
化合物26	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジヒドロキシベ ンズアルデヒド	
化合物27	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	ベンズアルデヒド	
化合物28	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-フルオロベンズア ルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物29	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物30	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物31	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物32	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-クロロ-4-フル オロベンズアルデヒド	
化合物33	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-トリフルオロメトキ シベンズアルデヒド	
化合物34	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ブromo-4-メトキ シベンズアルデヒド	
化合物35	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-クロロベンズアル デヒド	
化合物36	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 5-ジメチル-4- ヒドロキシベンズアル デヒド	
化合物37	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-エトキシ-4-ヒド ロキシベンズアルデヒ ド	
化合物38	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物39	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物40	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物41	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物42	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ヒドロキシ-3-メ チルベンズアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物43	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2, 5-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物44	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-フルオロ-5-トリ フルオロメチルベンズ アルデヒド	
化合物45	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	4-ヒドロキシ-3-メ チルベンズアルデヒド	
化合物46	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	2, 5-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物47	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物48	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物49	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	m-トルアルデヒド	
化合物50	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物51	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	p-トルアルデヒド	
化合物52	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-アリロキシベンズ アルデヒド	
化合物53	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 5-ジメトキシベン ズアルデヒド	
化合物54	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-[3-(トリフルオロメ チル)フェノキシ]ベンズ アルデヒド	
化合物55	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物56	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	



	A	B	C	B'
化合物57	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物58	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物59	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-クロロベンズアル デヒド	
化合物60	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-クロロベンズアル デヒド	
化合物61	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物62	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物63	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物64	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物65	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物66	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物67	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物68	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物69	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物70	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズ アルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物71	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物72	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物73	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物74	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物75	メチル 2-アミノ-4-クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物76	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物77	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物78	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物79	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物80	メチル 2-アミノベンゾエート	4-フルオロベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	
化合物81	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物82	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物83	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物84	メチル 2-アミノベンゾエート	3-フルオロベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物85	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物86	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-フルオロベンゾイ ルクロライド	4-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物87	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物88	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物89	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物90	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物91	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物92	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物93	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物94	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物95	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-フルオロベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物96	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-フルオロベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物97	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-プロモ-4-メトキ シベンズアルデヒド	
化合物98	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-プロモ-4-メトキ シベンズアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物99	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ブロモ-4-メトキ シベンズアルデヒド	
化合物100	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	3-ブロモ-4-メトキ シベンズアルデヒド	
化合物101	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-ブロモ-4-メトキ シベンズアルデヒド	
化合物102	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-ブロモ-4-メトキ シベンズアルデヒド	
化合物103	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ニトロベンズアル デヒド	
化合物104	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ジメチルアミノベン ズアルデヒド	
化合物105	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物106	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアル デヒド	
化合物107	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-クロロベンズアル デヒド	
化合物108	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイ ルクロライド	4-クロロベンズアル デヒド	
化合物109	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	4-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-ヒドロキシベンズ アルデヒド	
化合物110	メチル 2-アミノ-5 -ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ピリジンカルボキシ アルデヒド	
化合物111	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-ピリジンカルボキシ アルデヒド	
化合物112	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-メトキシベンゾイル クロライド	3-ピリジンカルボキシ アルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物113	メチル 2-アミノベン ゾエート	4-フルオロベンゾイ ルククロライド	3-ピリジンカルボキ シアルデヒド	
化合物114	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物115	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物116	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-クロロベンズアル デヒド	
化合物117	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-クロロベンズアル デヒド	
化合物118	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物119	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物120	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-トリフルオロメトキ シベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物121	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-トリフルオロメトキ シベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物122	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-トリフルオロメトキ シベンゾイルクロライド	3-クロロベンズアル デヒド	
化合物123	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-トリフルオロメトキ シベンゾイルクロライド	4-クロロベンズアル デヒド	
化合物124	メチル 2-アミノベン ゾエート	3-トリフルオロメトキ シベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物125	メチル 2-アミノ-5 -ヒドロキシベンゾエ ート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物126	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメトキシベン ズアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物127	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメトキシベン ズアルデヒド	
化合物128	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメトキシベン ズアルデヒド	
化合物129	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物130	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物131	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物132	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物133	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物134	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物135	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物136	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物137	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物138	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物139	メチル 2-アミノ-5- -ヒドロキシベンゾエ ート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物140	メチル 2-アミノ-5- -ヒドロキシベンゾエ ート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物141	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物142	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物143	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物144	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物145	メチル 2-アミノ-5- メトキシベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物146	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物147	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物148	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物149	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物150	メチル 2-アミノ-5- メチルベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物151	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物152	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物153	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物154	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	p-トルアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物155	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物156	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	2-フロイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物157	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	チオフェン-2-カル ボニルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物158	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	チオフェン-2-カル ボニルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物159	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	チオフェン-2-カル ボニルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物160	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	チオフェン-2-カル ボニルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物161	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	チオフェン-2-カル ボニルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物162	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	チオフェン-2-カル ボニルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物163	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物164	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物165	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物166	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物167	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物168	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	



	A	B	C	B'
化合物169	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物170	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物171	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物172	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物173	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物174	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物175	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物176	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物177	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物178	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エチルベンゾイル クロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物179	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エチルベンゾイル クロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物180	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エチルベンゾイル クロライド	m-トルアルデヒド	
化合物181	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エチルベンゾイル クロライド	p-トルアルデヒド	
化合物182	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エチルベンゾイル クロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物183	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	4-エチルベンゾイル クロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物184	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物185	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物186	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物187	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物188	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物189	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物190	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物191	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物192	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物193	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物194	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物195	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物196	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	4-メルカプトピリジン

	A	B	C	B'
化合物197	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベ ンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物198	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベ ンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物199	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベ ンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物200	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベ ンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物201	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	1-メチルピロール- 2-カルボキサルデヒ ド	
化合物202	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4,5-ジメチル-2-フ ランカルボキサルデヒ ド	
化合物203	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物204	メチル 2-アミノ-5- -ヨードベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物205	メチル 2-アミノ-5- -ヨードベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物206	メチル 2-アミノ-5- -ヨードベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物207	メチル 2-アミノ-5- -ヨードベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物208	メチル 2-アミノ-5- -ヨードベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	
化合物209	メチル 2-アミノ-5- -ヨードベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	
化合物210	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	1-メチルピロール- 2-カルボキサルデヒ ド	

	A	B	C	B'
化合物211	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	1-メチルピロール- 2-カルボキサルデヒ ド	
化合物212	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	1-メチルピロール- 2-カルボキサルデヒ ド	
化合物213	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロアセトフェ ノン	
化合物214	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロアセトフェ ノン	
化合物215	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	3-メチルアセトフェノ ン	
化合物216	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-メチルアセトフェノ ン	
化合物217	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4-メチルアセトフェノ ン	
化合物218	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フ ランカルボキサルデヒ ド	
化合物219	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フ ランカルボキサルデヒ ド	
化合物220	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フ ランカルボキサルデヒ ド	
化合物221	メチル 2-アミノ-5- プロモベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フ ランカルボキサルデヒ ド	
化合物222	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フ ランカルボキサルデヒ ド	
化合物223	メチル 2-アミノ-5- クロロベンゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	4,5-ジメチル-2-フ ランカルボキサルデヒ ド	
化合物224	メチル 2-アミノベン ゾエート	ベンゾイルクロライド	ベンズアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物225	メチル 2-アミノベン ゾエート	ベンゾイルクロライド	2-フルオロベンズアル デヒド	
化合物226	メチル 2-アミノベン ゾエート	ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物227	メチル 2-アミノ- 3, 4-ジメトキシベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	ベンズアルデヒド	
化合物228	メチル 2-アミノベン ゾエート	ベンゾイルクロライド	2-ブロモベンズアル デヒド	
化合物229	メチル 2-アミノベン ゾエート	ベンゾイルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物230	メチル 2-アミノ- 3, 4-ジメトキシベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	o-トルアルデヒド	
化合物231	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-クロロベンズアル デヒド	
化合物232	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	6-メトキシ-2-ナフ タルデヒド	
化合物233	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ビフェニルカルボ キサアルデヒド	
化合物234	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ブロモベンズアル デヒド	
化合物235	メチル 2-アミノベン ゾエート	ベンゾイルクロライド	トランス-シナムアル デヒド	
化合物236	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	2-フルオロベンズアル デヒド	
化合物237	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアル デヒド	
化合物238	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	m-トルアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物239	メチル 2-アミノベン ゾエート	2-フルオロベンゾイ ルクロライド	2-ヒドロキシ-3- tert-ブチルベンズア ルデヒド	
化合物240	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ニトロベンズアル デヒド	
化合物241	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	4-ジエチルアミノベン ズアルデヒド	
化合物242	メチル 2-アミノ-5 -ヒドロキシベンゾエ ート	3, 5-ジメトキシベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	
化合物243	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-ピリジルカルボキ サルデヒド	
化合物244	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-ピリジルカルボキ サルデヒド	
化合物245	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	2-ピリジルカルボキ サルデヒド	
化合物246	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	6-メチル-2-ピリジ ンカルボキサルデヒド	
化合物247	メチル 2-アミノベン ゾエート	3, 4-ジメトキシベン ゾイルクロライド	6-メチル-2-ピリジ ンカルボキサルデヒド	
化合物248	メチル 2-アミノ-5 -プロモベンゾエート	4-tert-ブチルベンゾ イルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物249	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	3-メチルアセトフェ ン	
化合物250	メチル 2-アミノ-5 -クロロベンゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	3-メチルアセトフェ ン	
化合物251	メチル 2-アミノベン ゾエート	ニコチノイル クロライ ド 塩酸塩	4-メチルアセトフェ ン	

	A	B	C	B'
化合物252	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	ニコチノイル クロライド 塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物253	メチル 2-アミノベン ゾエート	イソニコチノイル クロラ イド 塩酸塩	m-トルアルデヒド	
欠番				
化合物255	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物256	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物257	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物258	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物259	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物260	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物261	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	2-メルカプトエタノー ル
化合物262	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	2-メルカプトエタノー ル
化合物263	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノー ル
化合物264	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノー ル
化合物265	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	2-メルカプトエタノー ル
化合物266	メチル 2-アミノ-5- -プロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ペ ンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	2-メルカプトエタノー ル

	A	B	C	B'
化合物267	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物268	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物269	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物270	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物271	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物272	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物273	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物274	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物275	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物276	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物277	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物278	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物279	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物280	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物281	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物282	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン



	A	B	C	B'
化合物283	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物284	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物285	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物286	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物287	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物288	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物289	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物290	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物291	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物292	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物293	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物294	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物295	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物296	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物297	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物298	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン

	A	B	C	B'
化合物299	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物300	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)ジエタノールアミン
化合物301	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)ジエタノールアミン
化合物302	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)ジエタノールアミン
化合物303	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物304	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物305	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)アセチル)-モルホリン
化合物306	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)アセチル)-モルホリン
化合物307	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)アセチル)-モルホリン
化合物308	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物309	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物310	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物311	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物312	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物313	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物314	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン

	A	B	C	B'
化合物315	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物316	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物317	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物318	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物319	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物320	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物321	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物322	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物323	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物324	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物325	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物326	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物327	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物328	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物329	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物330	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン

	A	B	C	B'
化合物331	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物332	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物333	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物334	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物335	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物336	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物337	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物338	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物339	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物340	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物341	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物342	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物343	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物344	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物345	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物346	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シンナムアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物347	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シナナムアルデヒド	
化合物348	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シナナムアルデヒド	
化合物349	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	トランス-シナナムアルデヒド	
化合物350	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	3-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアルデヒド	
化合物351	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	3-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンズアルデヒド	
化合物352	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物353	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物354	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物355	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	2-メトキシシナナムアルデヒド	
化合物356	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物357	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-フルオロベンゼンチオール
化合物358	メチル 2-アミノベンゾエート	ニコチノイルクロライド塩酸塩	4-ジメチルアミノシナナムアルデヒド	
化合物359	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物360	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物361	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物362	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物363	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物364	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
欠番				
化合物366	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-メルカプトピリジン
化合物367	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物368	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物369	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物370	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物371	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物372	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物373	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物374	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物375	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物376	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物377	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物378	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン

	A	B	C	B'
化合物379	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物380	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物381	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物382	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物383	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物384	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物385	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物386	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物387	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物388	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物389	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物390	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物391	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物392	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物393	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物394	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール

	A	B	C	B'
化合物395	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物396	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物397	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物398	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物399	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物400	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物401	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物402	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物403	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物404	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物405	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物406	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物407	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物408	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物409	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物410	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン



	A	B	C	B'
化合物411	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物412	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物413	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物414	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物415	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物416	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物417	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物418	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物419	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物420	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物421	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(メチルアミノ)エタノール
化合物422	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物423	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物424	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物425	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物426	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール

	A	B	C	B'
化合物427	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物428	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物429	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物430	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物431	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物432	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物433	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物434	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物435	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物436	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物437	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物438	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物439	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物440	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物441	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-(エチルアミノ)エタノール
化合物442	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩

[illegible]

	A	B	C	B'
化合物459	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物460	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物461	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	2-ジエチルアミノエタンチオール塩酸塩
化合物462	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物463	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物464	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物465	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物466	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物467	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物468	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物469	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物470	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物471	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	1-(2-ジメチルアミノエチル)-5-メルカプトテトラゾール
化合物472	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物473	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物474	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン

	A	B	C	B'
化合物475	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物476	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物477	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物478	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物479	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物480	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物481	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物482	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物483	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物484	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物485	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物486	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物487	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物488	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物489	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物490	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-ヒドロキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン

	A	B	C	B'
化合物491	メチル 2-アミノ-5-ヨードベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-ヒドロキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物492	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物493	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物494	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-メチルベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物495	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物496	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物497	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	m-トルアルデヒド	
化合物498	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物499	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物500	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物501	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物502	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物503	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
化合物504	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-エトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物505	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物506	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-フルオロベンズアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物507	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物508	メチル 2-アミノベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物509	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	シクロヘキサンカルボニルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物510	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物511	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物512	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物513	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	イソキサゾール-5-カルボニルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物514	メチル 2-アミノベンゾエート	2, 5-ジメチルフラン-3-カルボニルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物515	メチル 2-アミノベンゾエート	2, 5-ジメチルフラン-3-カルボニルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	
化合物516	メチル 2-アミノベンゾエート	2, 5-ジメチルフラン-3-カルボニルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物517	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物518	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	
化合物519	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	
欠番				
化合物521	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物522	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	

	A	B	C	B'
化合物523	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物524	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物525	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物526	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物527	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物528	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物529	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物530	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物531	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物532	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物533	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物534	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物535	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物536	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物537	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物538	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフエン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン



	A	B	C	B'
化合物539	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物540	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物541	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物542	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物543	メチル 3-アミノ-4-メチルチオフェン-2-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物544	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	ピコリノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物545	メチル 2-アミノベンゾエート	イソニコチノイルクロライド塩酸塩	p-トルアルデヒド	
化合物546	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物547	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物548	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3, 4-ジメトキシベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物549	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物550	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物551	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物552	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物553	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物554	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール

	A	B	C	B'
化合物555	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4- トリアゾール
化合物556	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	3-メルカプト-1, 2, 4- トリアゾール
化合物557	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3, 4-ジメチルベンズア ルデヒド	3-メルカプト-1-プロパ ノール
化合物558	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパ ノール
化合物559	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	3-メルカプト-1-プロパ ノール
化合物560	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾ イルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	3-メルカプト-1-プロパ ノール

	A	B	C	B'
化合物561	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物562	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物563	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物564	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物565	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物566	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物567	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物568	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物569	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物570	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物571	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物572	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物573	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物574	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物575	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン

	A	B	C	B'
化合物576	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物577	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物578	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物579	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物580	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物581	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物582	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物583	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物584	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物585	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物586	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物587	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物588	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物589	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物590	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン

	A	B	C	B'
化合物591	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物592	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物593	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物594	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物595	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物596	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物597	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物598	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物599	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物600	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物601	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物602	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物603	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物604	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物605	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール

	A	B	C	B'
化合物606	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物607	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物608	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物609	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物610	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物611	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物612	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物613	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物614	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物615	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン

	A	B	C	B'
化合物616	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物617	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物618	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物619	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物620	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メキシベンズアルデヒド	4-ピペリジノピペリジン
化合物621	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物622	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物623	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物624	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物625	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール

	A	B	C	B'
化合物626	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ビペラジンエタノール
化合物627	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物628	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物629	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物630	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物631	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物632	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物633	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物634	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物635	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物636	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物637	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物638	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン



	A	B	C	B'
化合物639	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物640	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物641	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物642	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物643	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物644	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物645	エチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物646	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリックアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール

	A	B	C	B'
化合物647	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物648	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物649	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物650	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物651	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2, 4-トリアゾール
化合物652	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物653	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物654	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物655	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物656	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物657	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフエン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジアミン
化合物658	エチル 2-アミノチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物659	エチル 2-アミノチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール
化合物660	エチル 2-アミノチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-1-プロパノール

	A	B	C	B'
化合物661	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	3-メルカプト-1-ブ ロパノール
化合物662	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	3-メルカプト-1-ブ ロパノール
化合物663	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	p-メトキシベンズアル デヒド	3-メルカプト-1-ブ ロパノール
化合物664	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	N, N-ジエチル-N' -メチルエチレンジアミ ン
化合物665	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N' -メチルエチレンジアミ ン
化合物666	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	N, N-ジエチル-N' -メチルエチレンジアミ ン
化合物667	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	3-フルオロベンズア ルデヒド	N, N-ジエチル-N' -メチルエチレンジアミ ン
化合物668	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフ ルオロメチルベンズア ルデヒド	N, N-ジエチル-N' -メチルエチレンジアミ ン
化合物669	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	p-メトキシベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N' -メチルエチレンジアミ ン
化合物670	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズ アルデヒド	ジイソプロパノールアミ ン
化合物671	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミ ン
化合物672	エチル 2-アミノチオ フェン-3-カルボキシ レート	3-(クロロメチル)ベン ゾイルクロライド	4-フルオロベンズア ルデヒド	ジイソプロパノールアミ ン

	A	B	C	B'
化合物673	エチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物674	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物675	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッドエチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物676	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物677	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物678	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物679	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物680	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	フルフリルメルカプタン
化合物681	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	フルフリルメルカプタン
化合物682	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	フルフリルメルカプタン
化合物683	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	フルフリルメルカプタン
化合物684	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N'-ジメチル-1, 3-プロパンジアミン
化合物685	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N'-ジメチル-1, 3-プロパンジアミン
化合物686	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	フルフリルメルカプタン

	A	B	C、	B'
化合物687	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物688	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物689	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物690	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 6-ヘキサンジアミン
化合物691	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物692	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物693	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物694	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルフォニックアシッド ナトリウム塩
化合物695	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物696	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物697	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物698	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物699	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	フルフリル メルカプタン
化合物700	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	フルフリル メルカプタン

化合物701	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	N,N'-ジメチル-1, 3- プロパンジアミン
化合物702	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 3- プロパンジアミン
化合物703	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスル フォニックアシッド ナトリウ ム塩
化合物704	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	N,N'-ジメチル-1, 6- ヘキサンジアミン
化合物705	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	m-トルアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 6- ヘキサンジアミン
化合物706	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	N,N'-ジメチル-1, 6- ヘキサンジアミン
化合物707	メチル 3-アミノ-4-メチ ルチオフェン-2-カルボ キシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物708	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	2-メルカプトエタンスル フォニックアシッド ナトリウ ム塩
化合物709	メチル 2-アミノ-5-クロ ロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスル フォニックアシッド ナトリウ ム塩
化合物710	メチル 3-アミノ-4-メチ ルチオフェン-2-カルボ キシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N'-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物711	メチル 3-アミノ-4-メチ ルチオフェン-2-カルボ キシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	N, N'-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物712	メチル 3-アミノ-4-メチ ルチオフェン-2-カルボ キシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	N, N'-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物713	メチル 2-アミノ-5-ブ ロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	4-(2-アミノエチル)モル ホリン
化合物714	メチル 2-アミノ-5-ブ ロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モル ホリン
化合物715	メチル 2-アミノ-5-ブ ロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	4-(2-アミノエチル)モル ホリン

化合物716	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-(2-アミノエチル)モルホリン
化合物717	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(4-フルオロフェニル)ピペラジン
化合物718	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物719	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物720	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物721	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物722	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物723	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物724	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物725	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物726	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物727	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	シネフェリン
化合物728	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物729	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物730	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン

化合物731	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物732	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N-(2-(1-ピペラジノ)-アセチル)-モルホリン
化合物733	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3,4-ジメチルベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物734	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物735	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物736	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物737	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物738	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物739	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物740	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	ビス(2-エトキシエチル)アミン
化合物741	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物742	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物743	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物744	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物745	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール



化合物746	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンエタノール
化合物747	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-モルホリン-4-イル-1-フェニルエチルアミン
化合物748	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-モルホリン-4-イル-1-フェニルエチルアミン
化合物749	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物750	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物751	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物752	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物753	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物754	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物755	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物756	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-アミノ-1, 2-ジエチルピラゾリジン
化合物757	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物758	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物759	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物760	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン

化合物761	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物762	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物763	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	N-(3-アミノプロピル)-N-メチルアニリン
化合物764	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3,4-ジメチルベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物765	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物766	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-トルアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物767	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物768	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物769	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物770	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン

化合物771	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	2-(エチルチオ)エチルアミン
化合物772	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物773	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物774	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物775	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物776	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物777	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物778	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	4-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	m-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ピリジル)ピペラジン
化合物779	エチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物780	エチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン

化合物781	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホン尼克アシッド
化合物782	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホン尼克アシッド
化合物783	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホン尼克アシッド
化合物784	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホン尼克アシッド
化合物785	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタンスルホン尼克アシッド

	A	B	C	B'
化合物786	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物787	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物788	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物789	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物790	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物791	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジエタノールアミン
化合物792	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物793	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物794	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物795	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物796	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物797	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物798	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物799	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物800	エチル-2-アミノ-ベンゾ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール

	A	B	C	B'
化合物801	エチル-2-アミノベンゾ (B)チオフエン-3-カルボ キシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物802	エチル-2-アミノベンゾ (B)チオフエン-3-カルボ キシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物803	エチル-2-アミノベンゾ (B)チオフエン-3-カルボ キシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	4-ピペリジンメタノール
化合物804	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物805	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物806	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物807	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物808	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物809	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	ジイソプロパノールアミン
化合物810	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	N, N-ジエチルエチレンジ アミン
化合物811	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジ アミン
化合物812	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチルエチレンジ アミン
化合物813	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチルエチレンジ アミン
化合物814	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチルエチレンジ アミン
化合物815	エチル-2-アミノシクロペ ンタ(B)チオフエン-3-カ ルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	N, N-ジエチルエチレンジ アミン

	A	B	C	B'
化合物816	エチル-2-アミノシクロペンタ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物817	エチル-2-アミノシクロペンタ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物818	エチル-2-アミノシクロペンタ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物819	エチル-2-アミノシクロペンタ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物820	エチル-2-アミノシクロペンタ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物821	エチル-2-アミノシクロペンタ(B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	4-ピペリジンメタノール
化合物822	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジメチルアミン ハイドロクロライド
化合物823	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジメチルアミン ハイドロクロライド
化合物824	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジメチルアミン ハイドロクロライド
化合物825	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジメチルアミン ハイドロクロライド
化合物826	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ピリミジル)ピペラジン
化合物827	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ピリミジル)ピペラジン
化合物828	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ピリミジル)ピペラジン
化合物829	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ピリミジル)ピペラジン
化合物830	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ピリミジル)ピペラジン

	A	B	C	B'
化合物831	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ピリミジル)ピペラジン
化合物832	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1, 4-ジオキサー-8-アザスピロ[4, 5]デカン
化合物833	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1, 4-ジオキサー-8-アザスピロ[4, 5]デカン
化合物834	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1, 4-ジオキサー-8-アザスピロ[4, 5]デカン
化合物835	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1, 4-ジオキサー-8-アザスピロ[4, 5]デカン
化合物836	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1, 4-ジオキサー-8-アザスピロ[4, 5]デカン
化合物837	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1, 4-ジオキサー-8-アザスピロ[4, 5]デカン
化合物838	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物839	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物840	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物841	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物842	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物843	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物844	エチル 2-アミノ-4, 5-ジメチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物845	エチル 2-アミノ-4, 5-ジメチルチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン



	A	B	C	B'
化合物846	エチル 2-アミノ-4, 5-ジメチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物847	エチル 2-アミノ-4, 5-ジメチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物848	エチル 2-アミノ-4, 5-ジメチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物849	エチル 2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ(B)チオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物850	エチル 2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ(B)チオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物851	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物852	メチル 2-アミノ-4-メチルチオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物853	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物854	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物855	エチル 2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ(B)チオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物856	エチル 2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ(B)チオフエン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物857	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物858	2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物859	2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物860	2-アミノ-5-ピペリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン

	A	B	C	B'
化合物861	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物862	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物863	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物864	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物865	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物866	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物867	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物868	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物869	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	4-ピペラジンエタノール
化合物870	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物871	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物872	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物873	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物874	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	4-ヒドロキシピペリジン
化合物875	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデ ヒド	4-ヒドロキシピペリジン

	A	B	C	B'
化合物876	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	2-(ジエラミノ)エタンチ オール
化合物877	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	2-(ジエラミノ)エタンチ オール
化合物878	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	2-(ジエラミノ)エタンチ オール
化合物879	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	2-(ジエラミノ)エタンチ オール
化合物880	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	2-メルカプトエタノール
化合物881	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物882	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	2-メルカプトエタノール
化合物883	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	2-メルカプトエタノール
化合物884	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物885	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	2-メルカプトエタノール
化合物886	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	3-メルカプトプロピオニッ クアシッド
化合物887	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプトプロピオニッ クアシッド
化合物888	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	3-メルカプトプロピオニッ クアシッド
化合物889	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプトプロピオニッ クアシッド
化合物890	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	3-メルカプトプロピオニッ クアシッド

	A	B	C	B'
化合物891	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	メルカプトアセチックアシッド
化合物892	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	メルカプトアセチックアシッド
化合物893	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	1, 2, 3, 4-テトラヒドロピ リド-[4, 3-b][1, 8]- ナフチリジン
化合物894	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	1, 2, 3, 4-テトラヒドロピ リド-[4, 3-b][1, 8]- ナフチリジン
化合物895	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	1, 2, 3, 4-テトラヒドロピ リド-[4, 3-b][1, 8]- ナフチリジン
化合物896	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	1, 2, 3, 4-テトラヒドロピ リド-[4, 3-b][1, 8]- ナフチリジン
化合物897	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	1, 2, 3, 4-テトラヒドロピ リド-[4, 3-b][1, 8]- ナフチリジン
化合物898	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	1, 2, 3, 4-テトラヒドロピ リド-[4, 3-b][1, 8]- ナフチリジン
化合物899	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	3-メルカプト-1, 2-プロ パンジオール
化合物900	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-1, 2-プロ パンジオール
化合物901	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	3-メルカプト-1, 2-プロ パンジオール
化合物902	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	3-メルカプト-1, 2-プロ パンジオール
化合物903	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-1, 2-プロ パンジオール
化合物904	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	3-メルカプト-1, 2-プロ パンジオール
化合物905	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチル ジエチレントリアミン

	A	B	C	B'
化合物906	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチル ジエチレントリアミン
化合物907	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチル ジエチレントリアミン
化合物908	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチル ジエチレントリアミン
化合物909	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチル ジエチレントリアミン
化合物910	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	1, 1, 7, 7-テトラエチル ジエチレントリアミン
化合物911	2-アミノ-5-ジブロピル アミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物912	2-アミノ-5-ジブロピル アミノ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物913	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	N, N-ビス(2-ヒドロキシ エチル)エチレンジアミン
化合物914	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ビス(2-ヒドロキシ エチル)エチレンジアミン
化合物915	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	N, N-ビス(2-ヒドロキシ エチル)エチレンジアミン
化合物916	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物917	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物918	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物919	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	2-メルカプトエタノール
化合物920	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール

	A	B	C	B'
化合物921	2-アミノ-5-ピロリジン-1-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物922	2-アミノ-5-(4-メチル-[1,4]ジアゼピン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物923	2-アミノ-5-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イル]-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物924	2-アミノ-5-[4-(2-ヒドロキシ-エチル)-ピペラジン-1-イル]-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物925	1-(4-アミノ-3-メトキシカルボニル-フェニル)-ピペリジン-3-カルボキシリックアシッド	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物926	2-アミノ-5-チオモルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物927	2-アミノ-5-チオモルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物928	2-アミノ-5-チオモルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物929	2-アミノ-5-チオモルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物930	メチル 2-アミノチオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジメチルアミン ハイドロクロライド
化合物931	2-アミノ-5-(4-メチル-[1,4]ジアゼピン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物932	2-アミノ-5-(4-メチル-[1,4]ジアゼピン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物933	2-アミノ-5-(4-メチル-[1,4]ジアゼピン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物934	1-(4-アミノ-3-メトキシカルボニル-フェニル)-ピペリジン-3-カルボキシリックアシッド	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール

	A	B	C	B'
化合物935	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物936	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	ニコチンアルデヒド	
化合物937	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	イミダゾール-2-カルボ キサルアデヒド	
化合物938	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	バニリン	
化合物939	2-アミノ-5-モルホリン -4-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	
化合物940	2-アミノ-5-モルホリン -4-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	バニリン	
化合物941	2-アミノ-5-モルホリン -4-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3, 4-ジメトキシベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	
化合物942	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物943	2-アミノ-5-ヒドロキシ -ベンゾイックアシッド メチ ルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物944	2-アミノ-5-(2-オキ ソ-ピロリジン-1-イル) ベンゾイックアシッド メチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物945	2-アミノ-5-(2-オキ ソ-ピロリジン-1-イル) ベンゾイックアシッド メチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物946	2-アミノ-5-(2-オキ ソ-ピロリジン-1-イル) ベンゾイックアシッド メチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	ジイソプロパノールアミン
化合物947	2-アミノ-5-(2-オキ ソ-ピロリジン-1-イル) ベンゾイックアシッド メチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-フルオロベンズアルデ ヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物948	2-アミノ-5-(2-オキ ソ-ピロリジン-1-イル) ベンゾイックアシッド メチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物949	2-アミノ-5-ヒドロキシ -ベンゾイックアシッド メチ ルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン

	A	B	C	B'
化合物950	2-アミノ-5-ヒドロキシ -ベンゾイックアシッド メチ ルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物951	2-アミノ-5-ヒドロキシ -ベンゾイックアシッド メチ ルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物952	2-アミノ-5-ヒドロキシ -ベンゾイックアシッド メチ ルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物953	2-アミノ-5-ヒドロキシ -ベンゾイックアシッド メチ ルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物954	2-アミノ-5-ヒドロキシ -ベンゾイックアシッド メチ ルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物955	メチル 2-アミノチオフェ ン-3-カルボキシレート	3, 4-ジメチルベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	
化合物956	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジエチルアミン
化合物957	エチル 2-アミノ-4-メ チルチオフェン-3-カル ボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メチルベンズアルデヒ ド	ジエチルアミン
化合物958	2-アミノ-5-ピペリジン -1-イル-ベンゾイックア シッド エチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メチルベンズアルデヒ ド	ジイソプロパノールアミン
化合物959	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物960	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物961	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物962	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物963	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メチルベンズアルデヒ ド	ジイソプロパノールアミン
化合物964	2-アミノ-ニコチノイック アシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	ジイソプロパノールアミン



	A	B	C	B'
化合物965	2-アミノ-ニコチノイック アシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物966	2-アミノ-ニコチノイック アシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物967	2-アミノ-ニコチノイック アシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物968	2-アミノ-ニコチノイック アシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	ジイソプロパノールアミン
化合物969	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	1-(2-ヒドロキシエチル) ピペラジン
化合物970	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル) ピペラジン
化合物971	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	1-(2-ヒドロキシエチル) ピペラジン
化合物972	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル) ピペラジン
化合物973	3-アミノ-ナフタレン-2 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	1-(2-ヒドロキシエチル) ピペラジン
化合物974	4-アミノ-チオフェン-3 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物975	4-アミノ-チオフェン-3 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	m-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物976	4-アミノ-チオフェン-3 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物977	4-アミノ-チオフェン-3 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物978	4-アミノ-チオフェン-3 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物979	4-アミノ-チオフェン-3 -カルボキシリックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	ジイソプロパノールアミン

	A	B	C	B'
化合物980	4-アミノ-チオフェン-3-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物981	4-アミノ-チオフェン-3-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物982	4-アミノ-チオフェン-3-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物983	4-アミノ-チオフェン-3-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物984	4-アミノ-チオフェン-3-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物985	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物986	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物987	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物988	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物989	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物990	2-アミノ-5-フルオロベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物991	3-アミノ-5-tert-ブチルチオフェン-2-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	1-(2-ヒドロキシエチル)ピペラジン
化合物992	3-アミノ-チオフェン-2-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物993	3-アミノ-チオフェン-2-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物995	3-アミノ-チオフェン-2-カルボキシリクアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	ジエチルアミン

	A	B	C	B'
化合物996	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロアセトフェノン	ジイソプロパノールアミン
化合物997	メチル 2-アミノ-5-ブロモベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシアセトフェノン	ジイソプロパノールアミン
化合物998	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-(3-ジメチルアミノプロポキシ)-ベンズアルデヒド	ジイソプロパノールアミン
化合物999	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-(3-ジメチルアミノプロポキシ)-ベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1000	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	(4-ホルミルフェノキシ)-アセティックアシッド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1001	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッド	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1002	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッド	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-(2-ヒドロキシエトキシ)-ベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1003	2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾチオフェン-3-カルボキシリクアシッド	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロアセトフェノン	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1004	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	キノキサリン-2-カルボニルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	
化合物1005	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	キノキサリン-2-カルボニルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	
化合物1006	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	キノキサリン-2-カルボニルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	
化合物1007	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1008	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1009	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1010	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール

	A	B	C	B'
化合物1011	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1012	メチル 2-アミノ-5-クロロベンゾエート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1013	2-アミノ-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1014	2-アミノ-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1015	2-アミノ-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1016	2-アミノ-4, 5-ビス-(2-メトキシ-エトキシ)-ベンゾイックアシッド エチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1017	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1018	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1019	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1020	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1021	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	3-メルカプト-プロパン-1, 2-ジオール
化合物1022	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1023	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1024	2-アミノ-5-メトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1025	2-アミノ-5-メトキシ-エトキシ-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン

	A	B	C	B'
化合物1026	2-アミノ-5-メトキシ- エトキシベンゾイックア シッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1027	2-アミノ-5-メトキシ- エトキシベンゾイックア シッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1028	2-アミノ-4, 5-ビス- (2-メトキシ-エトキシ)- ベンゾイックアシッドエチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1029	2-アミノ-4, 5-ビス- (2-メトキシ-エトキシ)- ベンゾイックアシッドエチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1030	2-アミノ-4, 5-ビス- (2-メトキシ-エトキシ)- ベンゾイックアシッドエチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1031	2-アミノ-4, 5-ビス- (2-メトキシ-エトキシ)- ベンゾイックアシッドエチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1032	2-アミノ-4, 5-ビス- (2-メトキシ-エトキシ)- ベンゾイックアシッドエチル エステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1033	2-アミノ-5-[2-(2- メトキシ-エトキシ)-エト キシ]-ベンゾイックアシッ ドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3-フルオロベンズアルデ ヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1034	2-アミノ-5-[2-(2- メトキシ-エトキシ)-エト キシ]-ベンゾイックアシッ ドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1035	2-アミノ-5-[2-(2- メトキシ-エトキシ)-エト キシ]-ベンゾイックアシッ ドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアル デヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1036	2-アミノ-5-[2-(2- メトキシ-エトキシ)-エト キシ]-ベンゾイックアシッ ドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1037	2-アミノ-5-[2-(2- メトキシ-エトキシ)-エト キシ]-ベンゾイックアシッ ドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1038	2-アミノ-5-(3-ピペリ ジン-1-イル-プロポキ シ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メ チルエチレンジアミン
化合物1039	2-アミノ-5-(3-ピペリ ジン-1-イル-プロポキ シ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオ ロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1040	2-アミノ-5-(3-ピペリ ジン-1-イル-プロポキ シ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイ ルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒ ド	2-メルカプト-エタノール

	A	B	C	B'
化合物1041	2-アミノ-5-(3-ピペリジン-1-イル-プロポキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1042	2-アミノ-5-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1043	2-アミノ-5-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1044	2-アミノ-5-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1045	2-アミノ-5-(2-ピペリジン-1-イル-エトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1046	2-アミノ-5-シクロヘキシルメトキシ-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1047	2-アミノ-5-シクロヘキシルメトキシ-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1048	2-アミノ-5-シクロヘキシルメトキシ-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1049	2-アミノ-5-シクロヘキシルメトキシ-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1050	2-アミノ-5-シクロヘキシルメトキシ-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1051	2-アミノ-5-(4-フルオロ-ブトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1052	2-アミノ-5-(4-フルオロ-ブトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1053	2-アミノ-5-(4-フルオロ-ブトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1054	2-アミノ-5-(4-フルオロ-ブトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール
化合物1055	2-アミノ-5-(4-フルオロ-ブトキシ)-ベンゾイックアシッドメチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプト-エタノール

	A	B	C	B'
化合物1056	エチル 2-アミノ-4, 5, 6, 7-テトラヒドロベンゾ (B)チオフェン-3-カルボキシレート	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	1, 1, 7, 7-テトラエチルジエチレントリアミン
化合物1057	2-アミノ-5-(4-フルオロ-プトキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-フルオロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1058	2-アミノ-5-(4-フルオロ-プトキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-トルアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1059	2-アミノ-5-(4-フルオロ-プトキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1060	2-アミノ-5-(4-フルオロ-プトキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	4-クロロ-3-トリフルオロメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1061	2-アミノ-5-(4-フルオロ-プトキシ)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1062	2-アミノ-5-(4-ヒドロキシ-ピペリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-トリフルオロメチル-4-クロロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1063	2-アミノ-5-(4-ヒドロキシメチル-ピペリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-トリフルオロメチル-4-クロロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1064	2-アミノ-5-モルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1065	2-アミノ-5-モルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-トリフルオロメチル-4-クロロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1066	2-アミノ-5-モルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1067	2-アミノ-5-[1, 4']ビピペリジニル-1'-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-トリフルオロメチル-4-クロロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1068	2-アミノ-5-[1, 4']ビピペリジニル-1'-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1069	2-アミノ-5-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1070	2-アミノ-5-(4-メチル-ピペリジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-トリフルオロメチル-4-クロロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール

	A	B	C	B'
化合物1071	2-アミノ-5-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1072	2-アミノ-5-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-トリフルオロメチル-4-クロロベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1073	2-アミノ-5-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	2-メルカプトエタノール
化合物1074	2-アミノ-5-モルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3, 4-ジメチルベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1075	2-アミノ-5-モルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	3-トリフルオロメチル-4-クロロベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン
化合物1076	2-アミノ-5-モルホリン-4-イル-ベンゾイックアシッド メチルエステル	3-(クロロメチル)ベンゾイルクロライド	p-メトキシベンズアルデヒド	N, N-ジエチル-N'-メチルエチレンジアミン



化合物 853、854、857～929、931～942、944～948、958～973、985～990、1013～1055、および1057～1076の合成に当たって、化合物Aに相当する化合物の合成に使用した原料化合物および反応経路を示すと表2の通りである。表中化合物A'、D、およびEは実施例およびスキームA～Hにおいて示された化合物に対応する。

表 2

	A'	D	E	反応経路
化合物853	2-アミノ-5-フルオロ ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物854	2-アミノ-5-フルオロ ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物857	2-アミノ-5-フルオロ ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物858	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物859	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物860	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物861	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物862	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物863	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物864	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物865	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物866	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物867	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物868	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物869	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物870	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物871	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物872	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA

	A'	D	E	反応経路
化合物873	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物874	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物875	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物876	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物877	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物878	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物879	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物880	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物881	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物882	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物883	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物884	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物885	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物886	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物887	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物888	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物889	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物890	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA

	A'	D	E	反応経路
化合物891	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物892	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物893	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物894	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物895	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物896	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物897	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物898	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物899	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物900	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物901	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物902	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物903	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物904	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物905	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物906	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物907	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物908	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA

	A'	D	E	反応経路
化合物909	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物910	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物911	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド メチルエステル	プロピオンアルデヒド		スキームH
化合物912	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド メチルエステル	プロピオンアルデヒド		スキームH
化合物913	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物914	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物915	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物916	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピロリジン		スキームA
化合物917	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピロリジン		スキームA
化合物918	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピロリジン		スキームA
化合物919	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピロリジン		スキームA
化合物920	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピロリジン		スキームA
化合物921	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピロリジン		スキームA
化合物922	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	1-メチルホモピペラジ ン		スキームA
化合物923	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	1-ピペラジンエタノー ル		スキームA
化合物924	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	1-ピペラジンエタノー ル		スキームA
化合物925	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	3-ピペリジンカルボキ シリックアシッド		スキームA
化合物926	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	チオモルホリン		スキームA

	A'	D	E	反応経路
化合物927	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	チオモルホリン		スキームA
化合物928	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	チオモルホリン		スキームA
化合物929	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	チオモルホリン		スキームA
化合物931	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	1-メチルホモピペラジ ン		スキームA
化合物932	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	1-メチルホモピペラジ ン		スキームA
化合物933	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	1-メチルホモピペラジ ン		スキームA
化合物934	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	3-ピペリジンカルボキ シリックアシッド		スキームA
化合物935	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物936	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物937	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物938	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物939	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物940	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物941	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物942	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物944	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリルク ロライド		スキームD
化合物945	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリルク ロライド		スキームD
化合物946	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリルク ロライド		スキームD

	A'	D	E	反応経路
化合物947	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリル クロライド		スキームD
化合物948	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリル クロライド		スキームD
化合物958	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物959	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物960	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物961	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物962	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物963	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物964	2-アミノ-ニコチノイ クアシッド			スキームG
化合物965	2-アミノ-ニコチノイ クアシッド			スキームG
化合物966	2-アミノ-ニコチノイ クアシッド			スキームG
化合物967	2-アミノ-ニコチノイ クアシッド			スキームG
化合物968	2-アミノ-ニコチノイ クアシッド			スキームG
化合物969	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物970	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物971	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物972	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物973	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG

	A'	D	E	反応経路
化合物985	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物986	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物987	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物988	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物989	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物990	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物1013	3, 4-ジヒドロキシ-ベ ンゾイックアシッド エチ ルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ -エタン		スキームF
化合物1014	3, 4-ジヒドロキシ-ベ ンゾイックアシッド エチ ルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ -エタン		スキームF
化合物1015	3, 4-ジヒドロキシ-ベ ンゾイックアシッド エチ ルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ -エタン		スキームF
化合物1016	3, 4-ジヒドロキシ-ベ ンゾイックアシッド エチ ルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ -エタン		スキームF
化合物1017	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1018	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1019	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1020	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1021	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1022	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1023	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1024	5-メトキシ-2-ニト ロ-ベンゾイックアシッド			スキームE



	A'	D	E	反応経路
化合物1025	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームB
化合物1026	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームB
化合物1027	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームB
化合物1028	3, 4-ジヒドロキシ-ベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1029	3, 4-ジヒドロキシ-ベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1030	3, 4-ジヒドロキシ-ベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1031	3, 4-ジヒドロキシ-ベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1032	3, 4-ジヒドロキシ-ベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1033	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1034	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1035	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1036	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1037	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1038	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1039	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1040	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1041	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1042	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC

	A'	D	E	反応経路
化合物1043	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC
化合物1044	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC
化合物1045	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC
化合物1046	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1047	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1048	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1049	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1050	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1051	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1052	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1053	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1054	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1055	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1057	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1058	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1059	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1060	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB
化合物1061	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-4-フルオロブタン		スキームB

	A'	D	E	反応経路
化合物1062	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-ヒドロキシピペリジン		スキームA
化合物1063	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-ピペリジンメタノール		スキームA
化合物1064	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1065	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1066	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1067	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-ピペリジノピペリジン		スキームA
化合物1068	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-ピペリジノピペリジン		スキームA
化合物1069	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペリジン		スキームA
化合物1070	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペリジン		スキームA
化合物1071	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペリジン		スキームA
化合物1072	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペラジン		スキームA
化合物1073	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペラジン		スキームA
化合物1074	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1075	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1076	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA

	A'	D	E	反応経路
化合物935	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物936	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物937	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物938	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物939	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物940	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物941	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物942	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物944	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリル クロライド		スキームD
化合物945	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリル クロライド		スキームD
化合物946	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリル クロライド		スキームD
化合物947	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリル クロライド		スキームD
化合物948	5-アミノ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-クロロ-ブチリル クロライド		スキームD
化合物958	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	ピペリジン		スキームA
化合物959	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリック アシッド			スキームG
化合物960	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリック アシッド			スキームG
化合物961	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリック アシッド			スキームG
化合物962	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリック アシッド			スキームG

	A'	D	E	反応経路
化合物963	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物964	2-アミノ-ニコチノイッ クアシッド			スキームG
化合物965	2-アミノ-ニコチノイッ クアシッド			スキームG
化合物966	2-アミノ-ニコチノイッ クアシッド			スキームG
化合物967	2-アミノ-ニコチノイッ クアシッド			スキームG
化合物968	2-アミノ-ニコチノイッ クアシッド			スキームG
化合物969	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物970	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物971	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物972	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物973	3-アミノ-ナフタレン- 2-カルボキシリックア シッド			スキームG
化合物985	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物986	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物987	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物988	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物989	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物990	2-アミノ-5-フルオロ -ベンゾイックアシッド			スキームG
化合物1013	3, 4-ジヒドロキシ-ベ ンゾイックアシッド エチ ルエステル	1-ブロモ-2-メキシ -エタン		スキームF

	A'	D	E	反応経路
化合物1014	3, 4-ジヒドロキシベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1015	3, 4-ジヒドロキシベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1016	3, 4-ジヒドロキシベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1017	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1018	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1019	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1020	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1021	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1022	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1023	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1024	5-メトキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド			スキームE
化合物1025	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームB
化合物1026	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームB
化合物1027	5-ヒドロキシ-2-ニトロベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームB
化合物1028	3, 4-ジヒドロキシベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1029	3, 4-ジヒドロキシベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1030	3, 4-ジヒドロキシベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1031	3, 4-ジヒドロキシベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF

	A'	D	E	反応経路
化合物1032	3, 4-ジヒドロキシ-ベンゾイックアシッド エチルエステル	1-ブロモ-2-メトキシ-エタン		スキームF
化合物1033	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1034	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1035	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1036	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1037	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-(2-メトキシ-エトキシ)-エタン		スキームB
化合物1038	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1039	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1040	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1041	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-3-クロロプロパン	ピペリジン	スキームC
化合物1042	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC
化合物1043	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC
化合物1044	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC
化合物1045	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-ブロモ-2-クロロエタン	ピペリジン	スキームC
化合物1046	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1047	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1048	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1049	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	ブロモメチル-シクロヘキサン		スキームB

	A'	D	E	反応経路
化合物1050	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	プロモメチル-シクロヘキサン		スキームB
化合物1051	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1052	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1053	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1054	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1055	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1057	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1058	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1059	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1060	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1061	5-ヒドロキシ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	1-プロモ-4-フルオロ-ブタン		スキームB
化合物1062	5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	4-ヒドロキシピペリジン		スキームA
化合物1063	5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	4-ピペリジンメタノール		スキームA
化合物1064	5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1065	5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1066	5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1067	5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	4-ピペリジノピペリジン		スキームA
化合物1068	5-クロロ-2-ニトロ-ベンゾイックアシッド	4-ピペリジノピペリジン		スキームA



	A'	D	E	反応経路
化合物1069	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペリジン		スキームA
化合物1070	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペリジン		スキームA
化合物1071	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペリジン		スキームA
化合物1072	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペラジン		スキームA
化合物1073	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	4-メチルピペラジン		スキームA
化合物1074	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1075	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA
化合物1076	5-クロロ-2-ニトロ- ベンゾイックアシッド	モルホリン		スキームA

化合物 1 ~ 1077 の構造を示すと表 3 の通りである。

表 3

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物 1		化合物 7	
化合物 2		化合物 8	
化合物 3		化合物 9	
化合物 4		化合物 10	
化合物 5		化合物 11	
化合物 6		化合物 12	

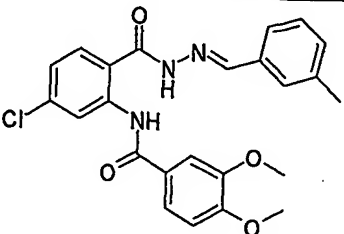
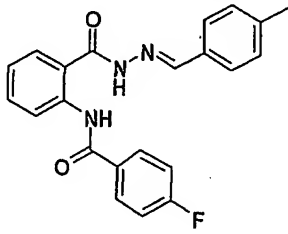
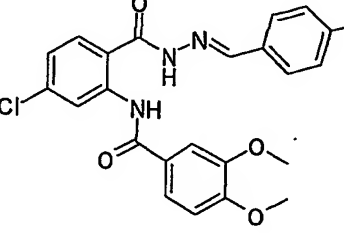
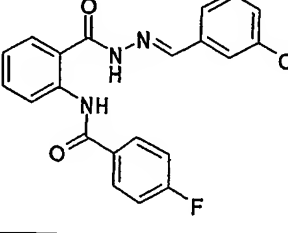
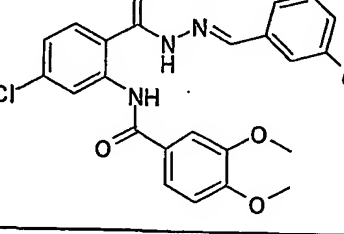
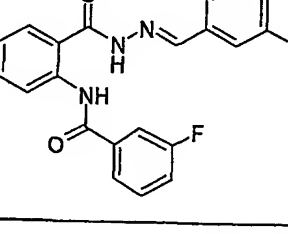
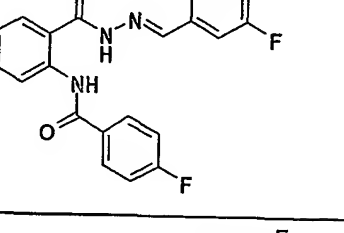
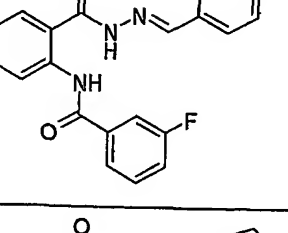
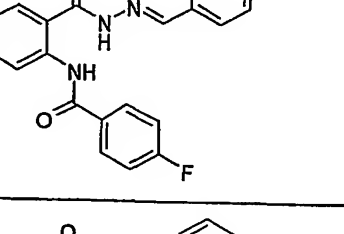
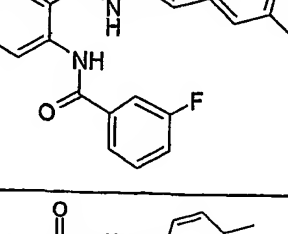
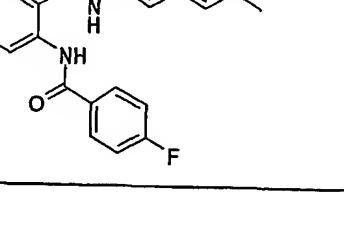
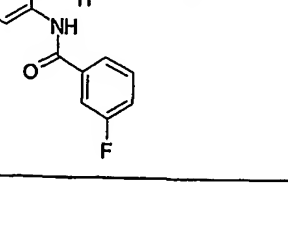
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物13		化合物19	
化合物14		化合物20	
化合物15		化合物21	
化合物16		化合物22	
化合物17		化合物23	
化合物18		化合物24	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物25		化合物31	
化合物26		化合物32	
化合物27		化合物33	
化合物28		化合物34	
化合物29		化合物35	
化合物30		化合物36	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物37		化合物43	
化合物38		化合物44	
化合物39		化合物45	
化合物40		化合物46	
化合物41		化合物47	
化合物42		化合物48	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物49		化合物55	
化合物50		化合物56	
化合物51		化合物57	
化合物52		化合物58	
化合物53		化合物59	
化合物54		化合物60	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物61		化合物67	
化合物62		化合物68	
化合物63		化合物69	
化合物64		化合物70	
化合物65		化合物71	
化合物66		化合物72	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物73		化合物79	
化合物74		化合物80	
化合物75		化合物81	
化合物76		化合物82	
化合物77		化合物83	
化合物78		化合物84	

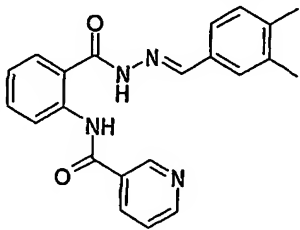
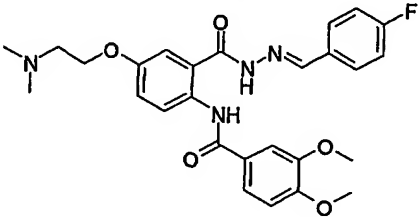
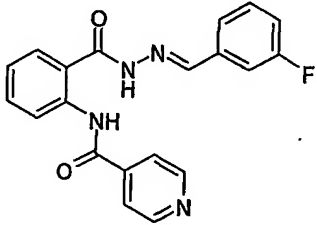
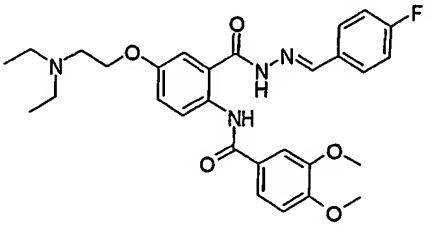
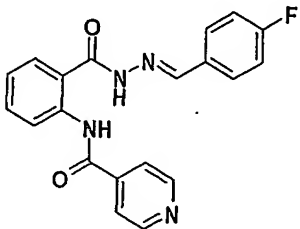
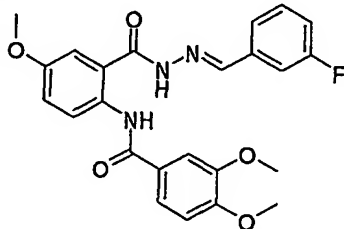
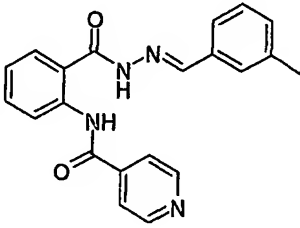
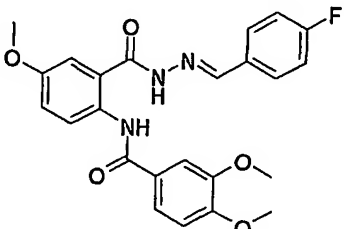
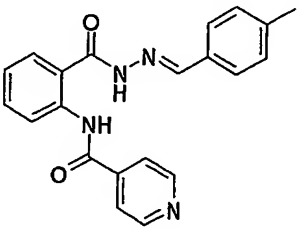
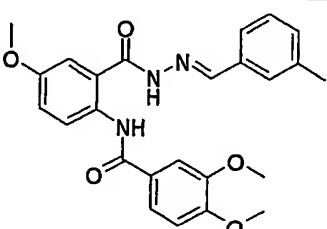
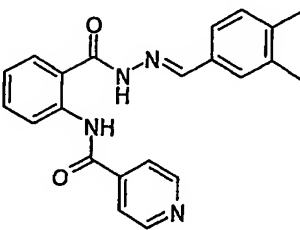
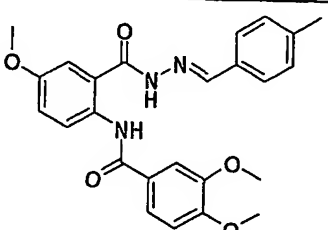


化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物85		化合物91	
化合物86		化合物92	
化合物87		化合物93	
化合物88		化合物94	
化合物89		化合物95	
化合物90		化合物96	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物97		化合物103	
化合物98		化合物104	
化合物99		化合物105	
化合物100		化合物106	
化合物101		化合物107	
化合物102		化合物108	

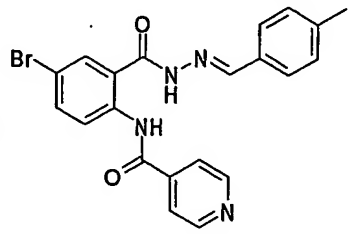
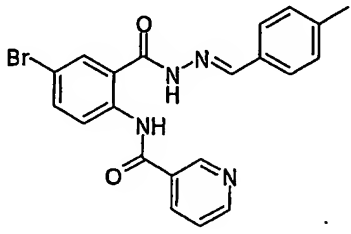
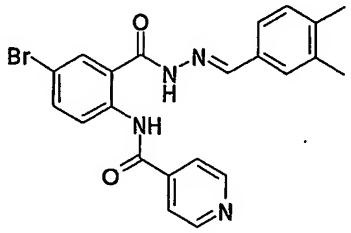
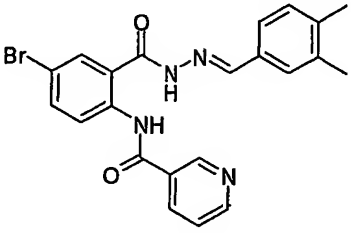
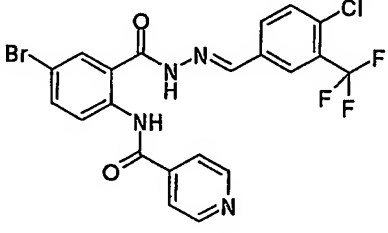
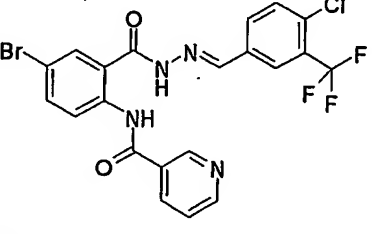
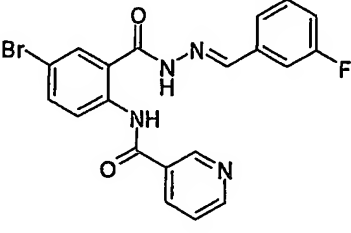
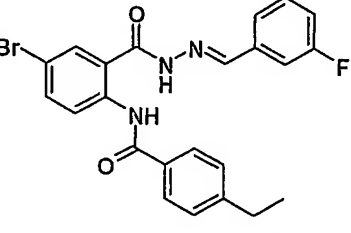
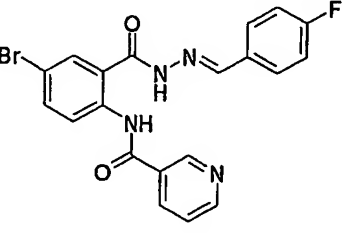
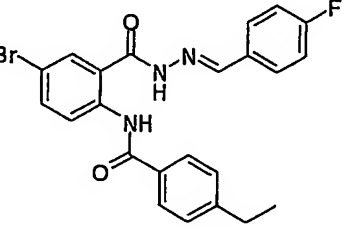
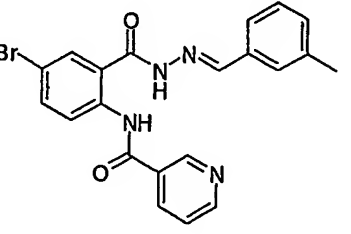
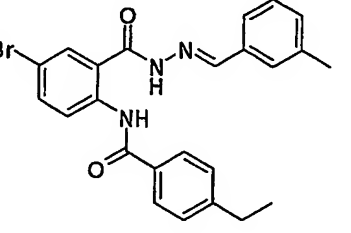
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物109		化合物115	
化合物110		化合物116	
化合物111		化合物117	
化合物112		化合物118	
化合物113		化合物119	
化合物114		化合物120	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物121		化合物127	
化合物122		化合物128	
化合物123		化合物129	
化合物124		化合物130	
化合物125		化合物131	
化合物126		化合物132	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物133		化合物139	
化合物134		化合物140	
化合物135		化合物141	
化合物136		化合物142	
化合物137		化合物143	
化合物138		化合物144	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物145		化合物151	
化合物146		化合物152	
化合物147		化合物153	
化合物148		化合物154	
化合物149		化合物155	
化合物150		化合物156	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物157		化合物163	
化合物158		化合物164	
化合物159		化合物165	
化合物160		化合物166	
化合物161		化合物167	
化合物162		化合物168	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物169		化合物175	
化合物170		化合物176	
化合物171		化合物177	
化合物172		化合物178	
化合物173		化合物179	
化合物174		化合物180	



化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物181		化合物187	
化合物182		化合物188	
化合物183		化合物189	
化合物184		化合物190	
化合物185		化合物191	
化合物186		化合物192	

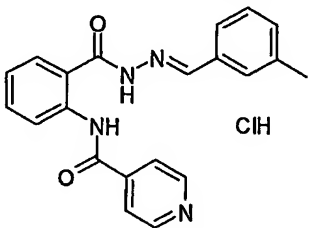
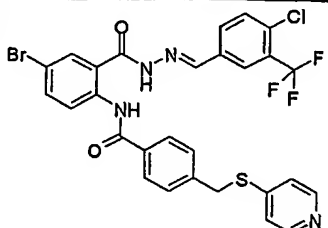
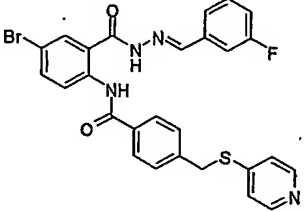
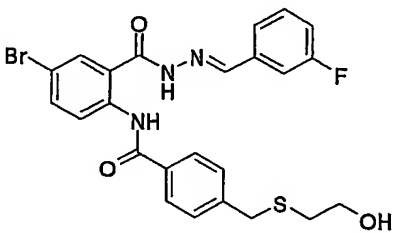
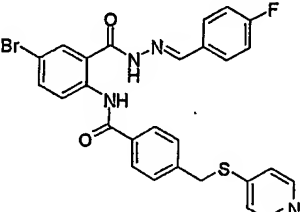
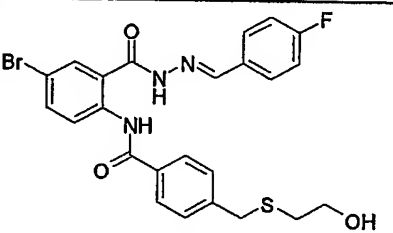
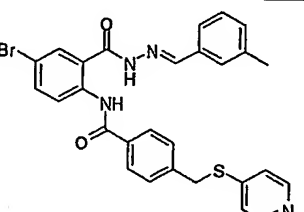
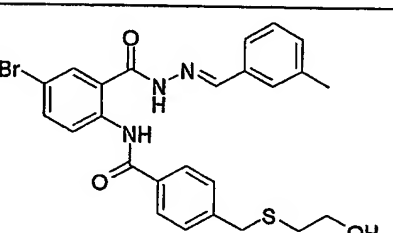
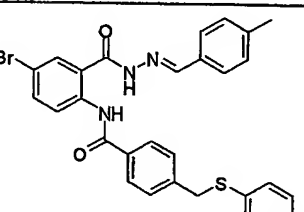
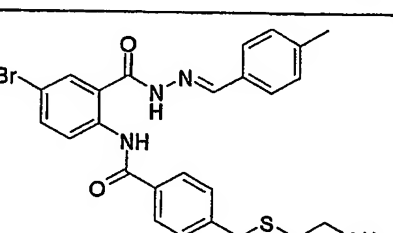
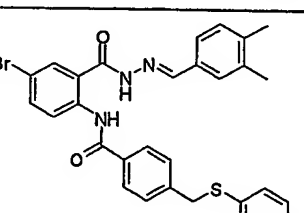
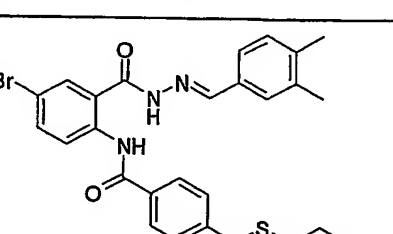
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物193		化合物199	
化合物194		化合物200	
化合物195		化合物201	
化合物196		化合物202	
化合物197		化合物203	
化合物198		化合物204	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物205		化合物211	
化合物206		化合物212	
化合物207		化合物213	
化合物208		化合物214	
化合物209		化合物215	
化合物210		化合物216	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物217		化合物223	
化合物218		化合物224	
化合物219		化合物225	
化合物220		化合物226	
化合物221		化合物227	
化合物222		化合物228	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物229		化合物235	
化合物230		化合物236	
化合物231		化合物237	
化合物232		化合物238	
化合物233		化合物239	
化合物234		化合物240	

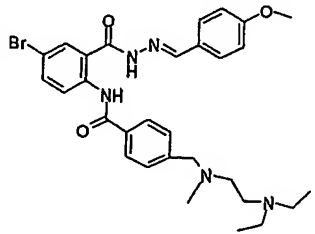
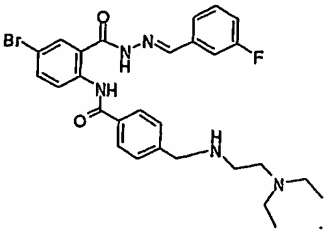
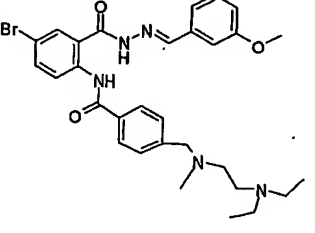
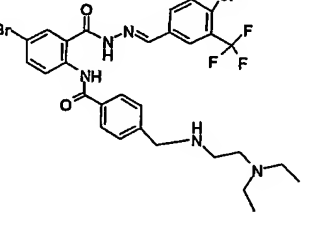
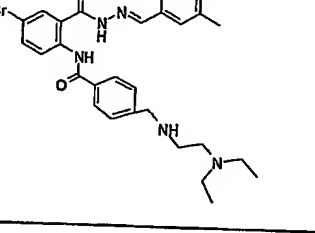
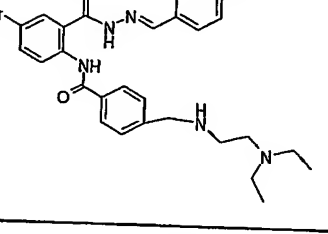
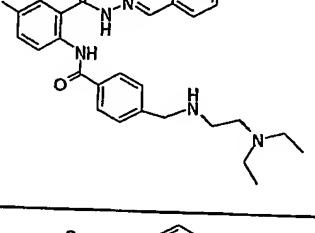
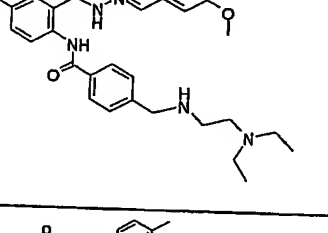
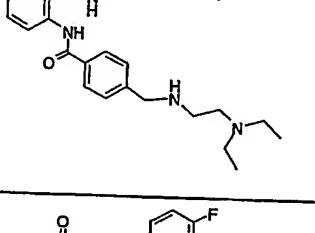
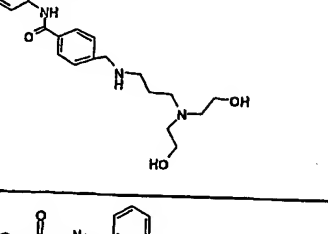
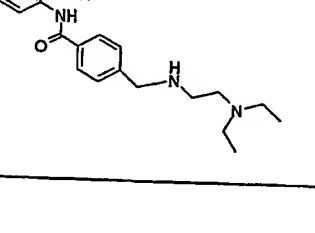
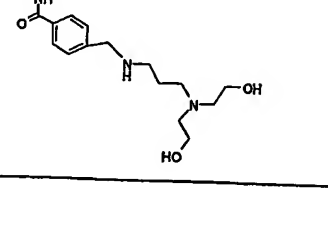
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物241		化合物247	
化合物242		化合物248	
化合物243		化合物249	
化合物244		化合物250	
化合物245		化合物251	
化合物246		化合物252	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物253	 ClH	化合物260	
化合物255		化合物261	
化合物256		化合物262	
化合物257		化合物263	
化合物258		化合物264	
化合物259		化合物265	

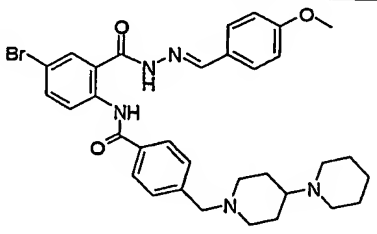
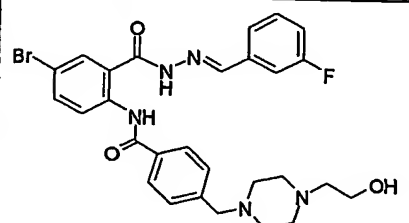
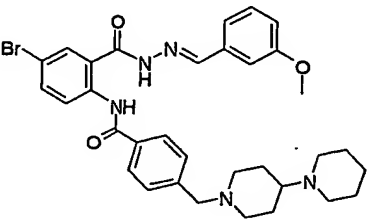
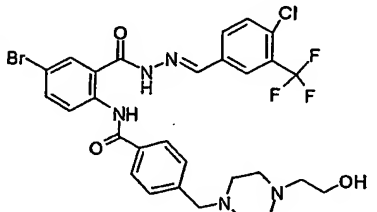
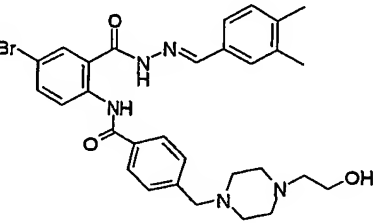
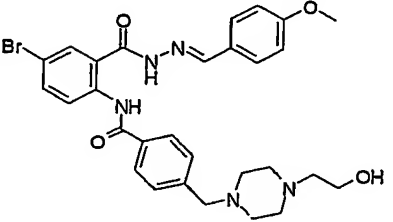
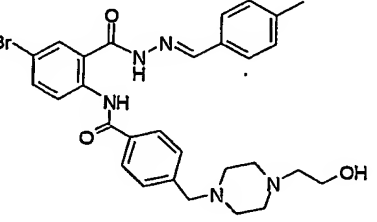
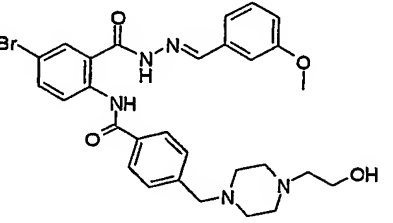
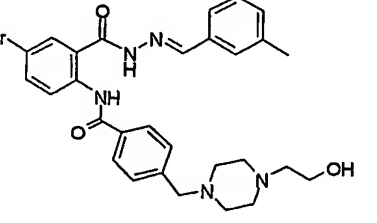
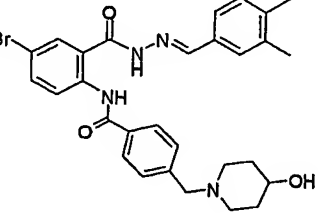
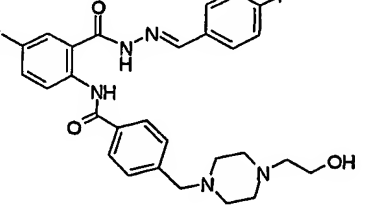
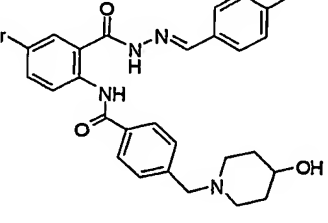
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物266		化合物272	
化合物267		化合物273	
化合物268		化合物274	
化合物269		化合物275	
化合物270		化合物276	
化合物271		化合物277	



化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物278		化合物284	
化合物279		化合物285	
化合物280		化合物286	
化合物281		化合物287	
化合物282		化合物288	
化合物283		化合物289	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物290		化合物296	
化合物291		化合物297	
化合物292		化合物298	
化合物293		化合物299	
化合物294		化合物300	
化合物295		化合物301	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物302		化合物308	
化合物303		化合物309	
化合物304		化合物310	
化合物305		化合物311	
化合物306		化合物312	
化合物307		化合物313	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物314		化合物320	
化合物315		化合物321	
化合物316		化合物322	
化合物317		化合物323	
化合物318		化合物324	
化合物319		化合物325	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物326		化合物332	
化合物327		化合物333	
化合物328		化合物334	
化合物329		化合物335	
化合物330		化合物336	
化合物331		化合物337	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物338		化合物344	
化合物339		化合物345	
化合物340		化合物346	
化合物341		化合物347	
化合物342		化合物348	
化合物343		化合物349	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物350		化合物356	
化合物351		化合物357	
化合物352		化合物358	
化合物353		化合物359	
化合物354		化合物360	
化合物355		化合物361	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物362		化合物369	
化合物363		化合物370	
化合物364		化合物371	
化合物366		化合物372	
化合物367		化合物373	
化合物368		化合物374	



化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物375		化合物381	
化合物376		化合物382	
化合物377		化合物383	
化合物378		化合物384	
化合物379		化合物385	
化合物380		化合物386	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物387		化合物393	
化合物388		化合物394	
化合物389		化合物395	
化合物390		化合物396	
化合物391		化合物397	
化合物392		化合物398	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物399		化合物405	
化合物400		化合物406	
化合物401		化合物407	
化合物402		化合物408	
化合物403		化合物409	
化合物404		化合物410	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物411		化合物417	
化合物412		化合物418	
化合物413		化合物419	
化合物414		化合物420	
化合物415		化合物421	
化合物416		化合物422	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物423		化合物429	
化合物424		化合物430	
化合物425		化合物431	
化合物426		化合物432	
化合物427		化合物433	
化合物428		化合物434	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物435		化合物441	
化合物436		化合物442	
化合物437		化合物443	
化合物438		化合物444	
化合物439		化合物445	
化合物440		化合物446	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物447		化合物453	
化合物448		化合物454	
化合物449		化合物455	
化合物450		化合物456	
化合物451		化合物457	
化合物452		化合物458	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物459		化合物465	
化合物460		化合物466	
化合物461		化合物467	
化合物462		化合物468	
化合物463		化合物469	
化合物464		化合物470	

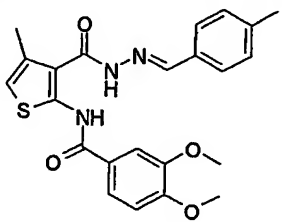
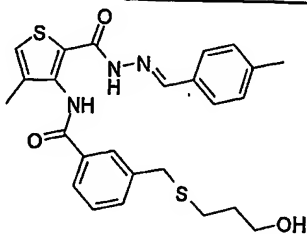
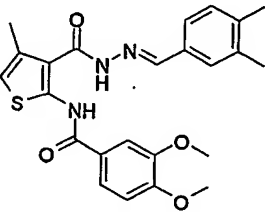
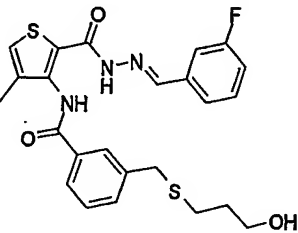
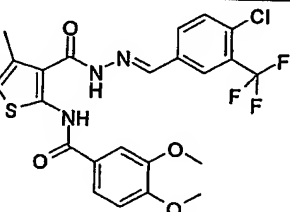
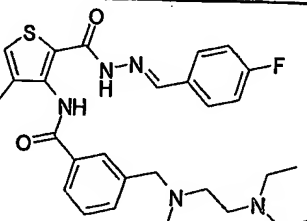
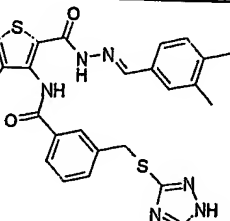
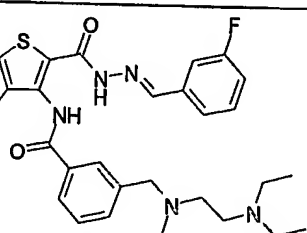
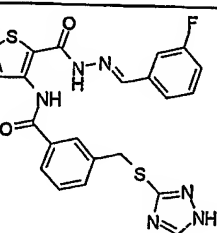
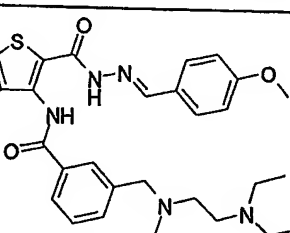
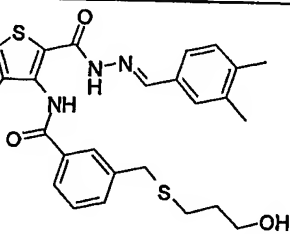
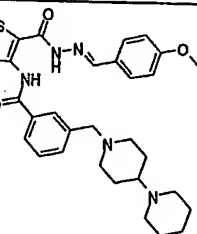


化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物471		化合物477	
化合物472		化合物478	
化合物473		化合物479	
化合物474		化合物480	
化合物475		化合物481	
化合物476		化合物482	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物483		化合物489	
化合物484		化合物490	
化合物485		化合物491	
化合物486		化合物492	
化合物487		化合物493	
化合物488		化合物494	

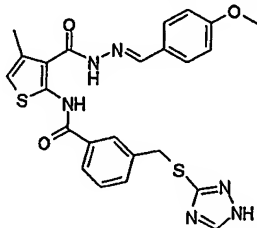
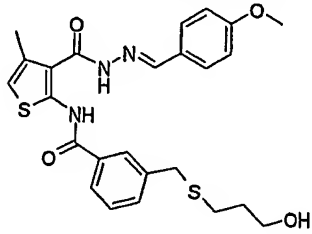
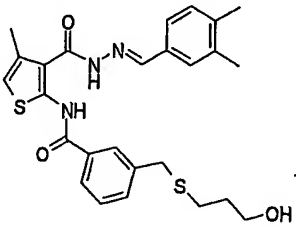
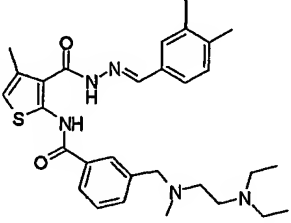
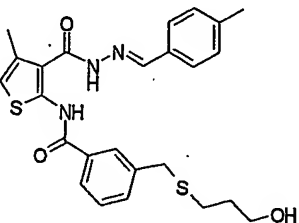
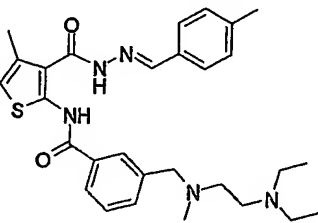
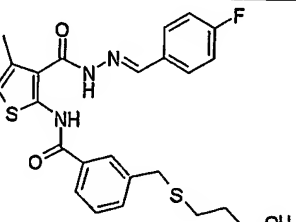
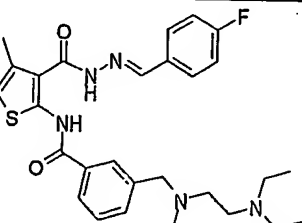
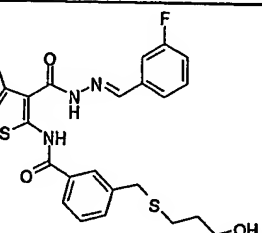
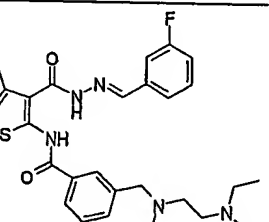
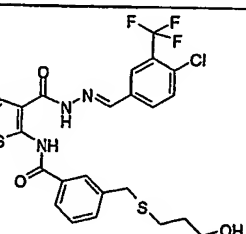
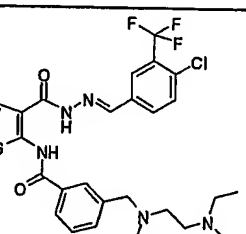
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物495		化合物501	
化合物496		化合物502	
化合物497		化合物503	
化合物498		化合物504	
化合物499		化合物505	
化合物500		化合物506	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物507		化合物513	
化合物508		化合物514	
化合物509		化合物515	
化合物510		化合物516	
化合物511		化合物517	
化合物512		化合物518	

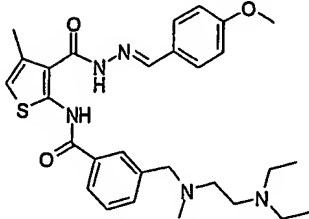
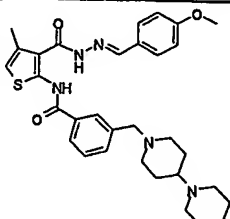
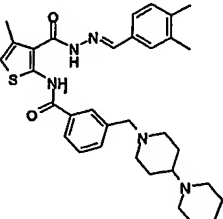
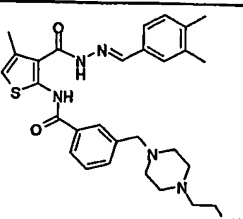
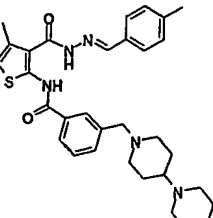
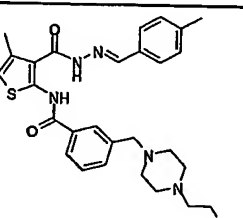
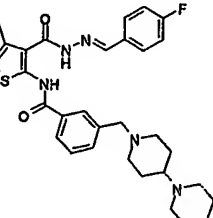
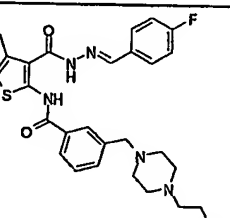
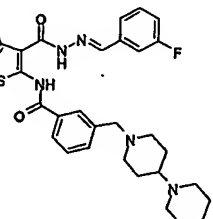
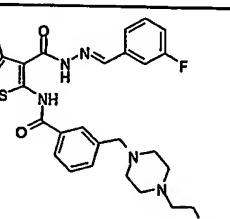
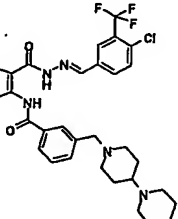
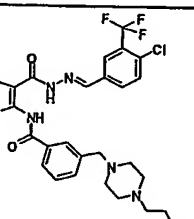
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物519		化合物526	
化合物521		化合物527	
化合物522		化合物528	
化合物523		化合物529	
化合物524		化合物530	
化合物525		化合物531	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物532		化合物538	
化合物533		化合物539	
化合物534		化合物540	
化合物535		化合物541	
化合物536		化合物542	
化合物537		化合物543	

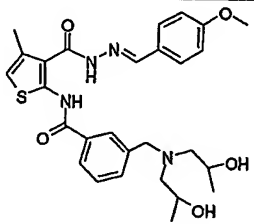
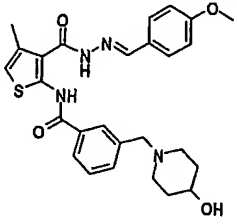
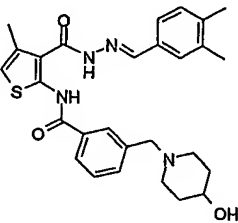
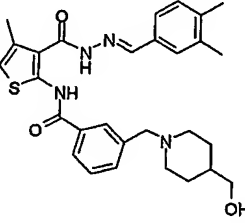
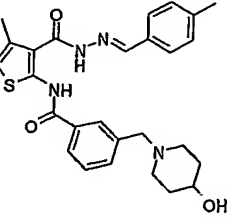
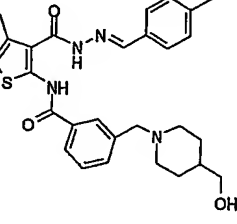
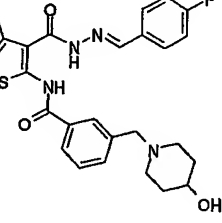
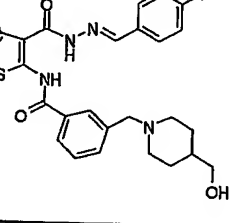
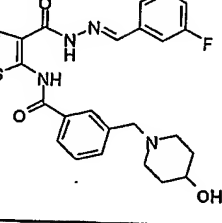
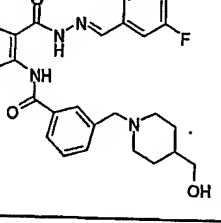
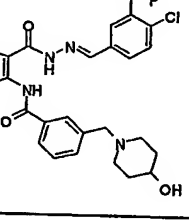
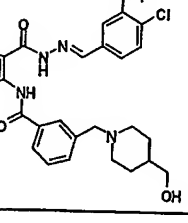
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物544		化合物550	
化合物545		化合物551	
化合物546		化合物552	
化合物547		化合物553	
化合物548		化合物554	
化合物549		化合物555	

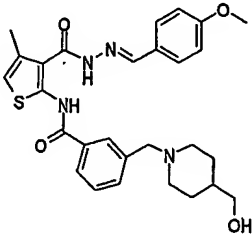
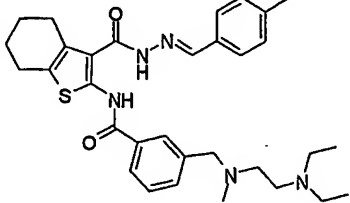
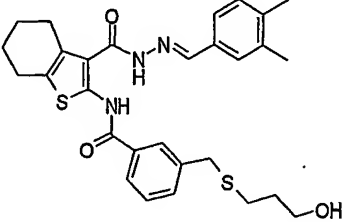
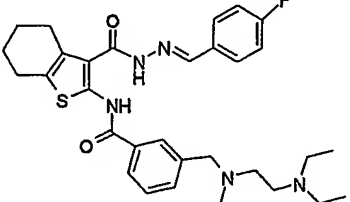
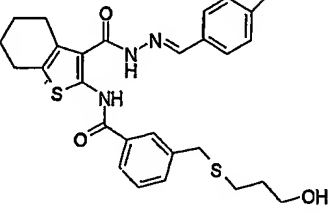
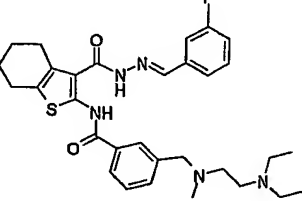
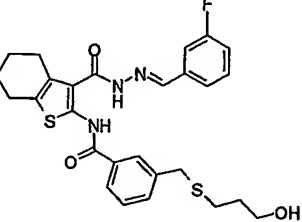
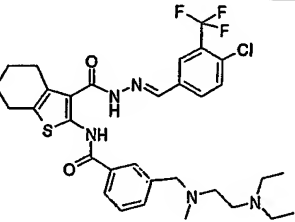
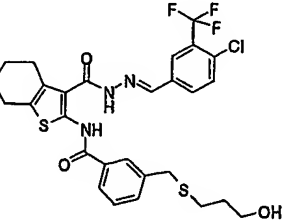
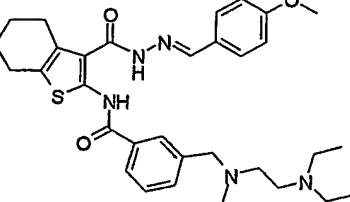
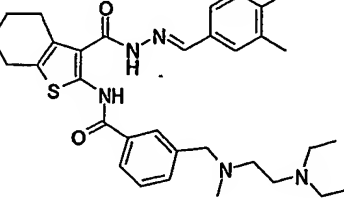
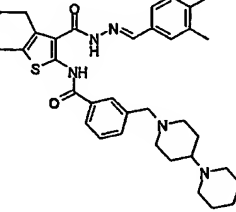
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物556		化合物562	
化合物557		化合物563	
化合物558		化合物564	
化合物559		化合物565	
化合物560		化合物566	
化合物561		化合物567	

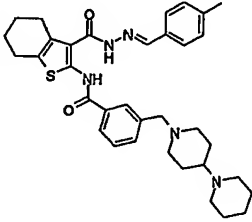
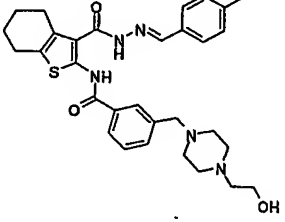
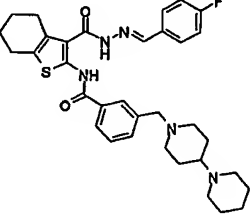
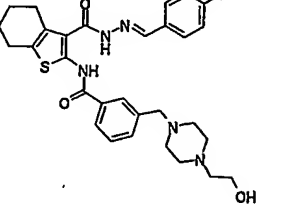
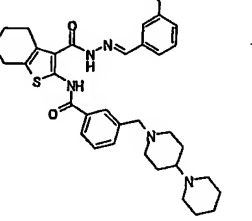
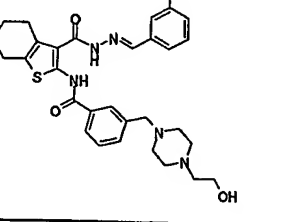
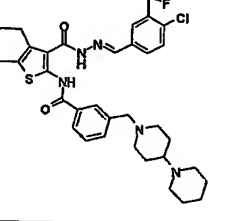
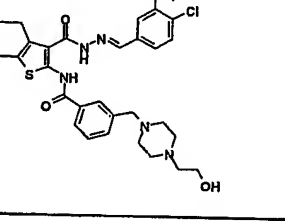
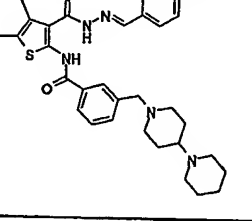
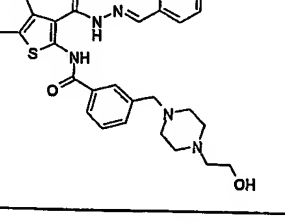
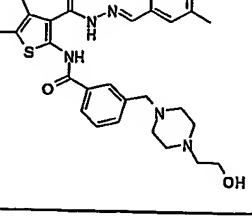
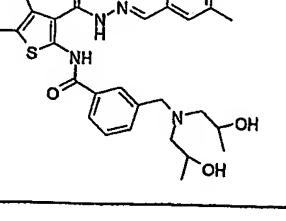


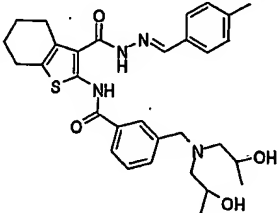
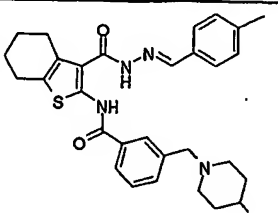
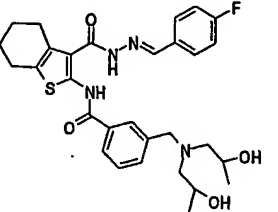
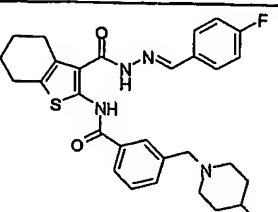
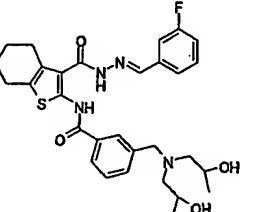
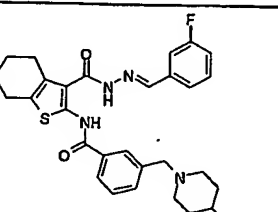
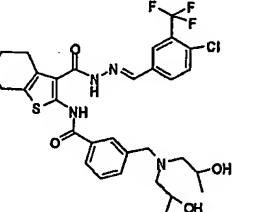
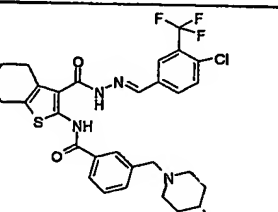
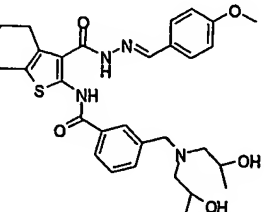
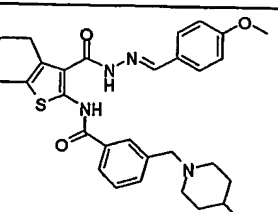
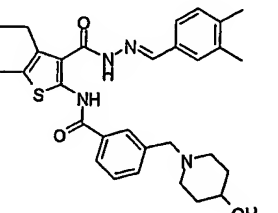
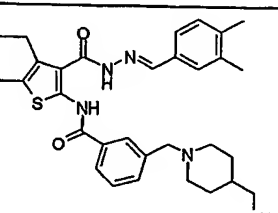
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物568		化合物574	
化合物569		化合物575	
化合物570		化合物576	
化合物571		化合物577	
化合物572		化合物578	
化合物573		化合物579	

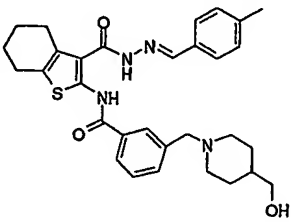
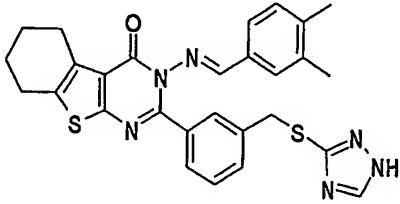
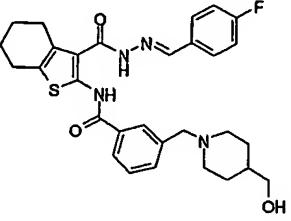
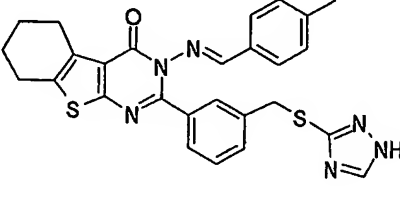
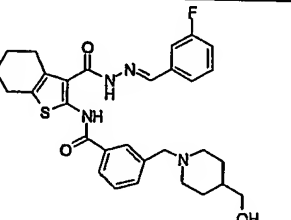
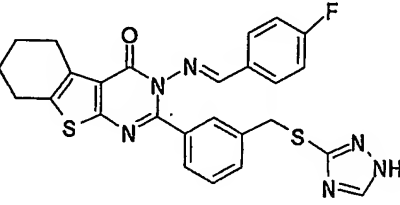
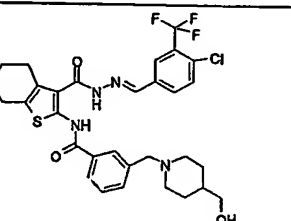
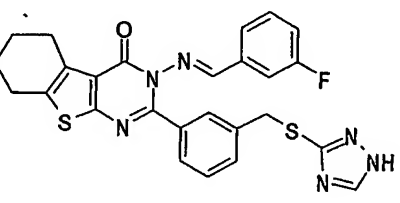
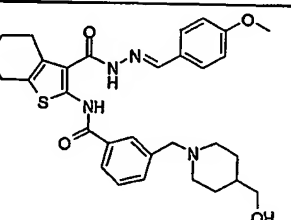
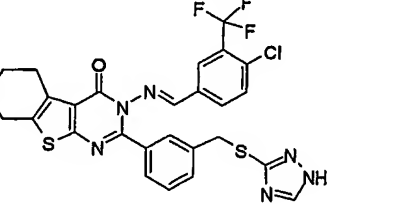
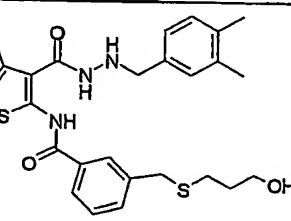
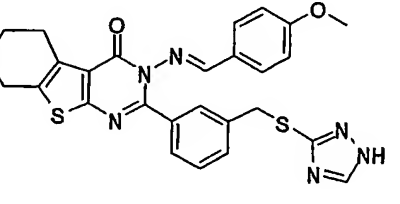
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物580		化合物586	
化合物581		化合物587	
化合物582		化合物588	
化合物583		化合物589	
化合物584		化合物590	
化合物585		化合物591	

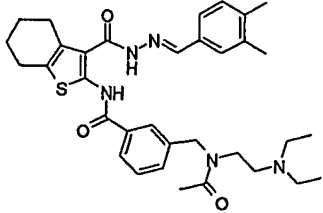
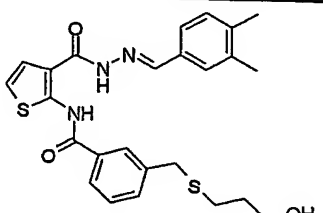
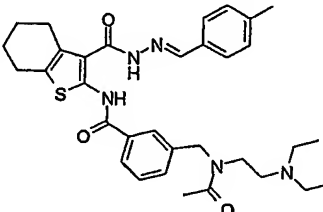
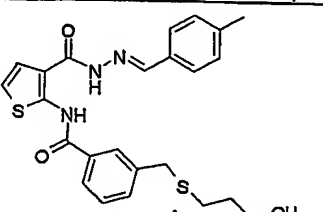
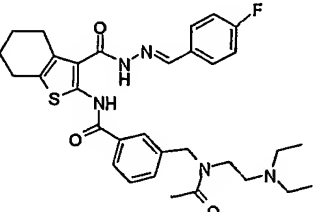
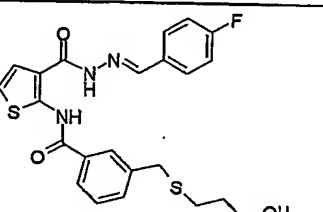
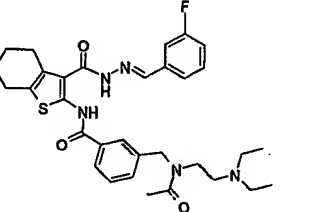
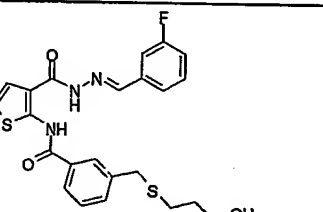
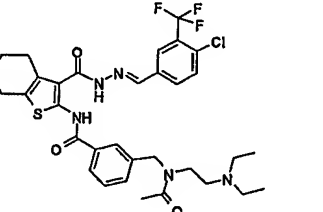
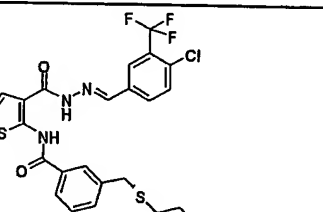
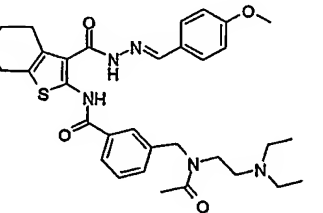
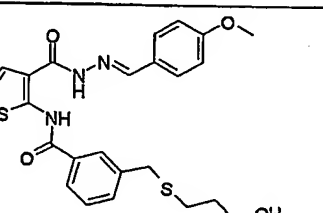
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物592		化合物598	
化合物593		化合物599	
化合物594		化合物600	
化合物595		化合物601	
化合物596		化合物602	
化合物597		化合物603	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物604		化合物610	
化合物605		化合物611	
化合物606		化合物612	
化合物607		化合物613	
化合物608		化合物614	
化合物609		化合物615	

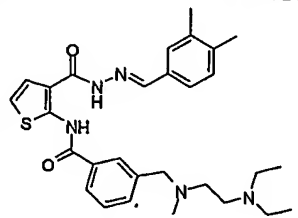
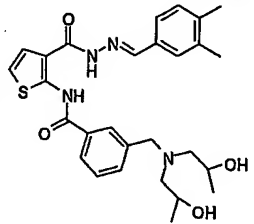
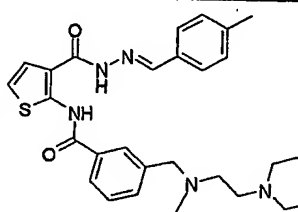
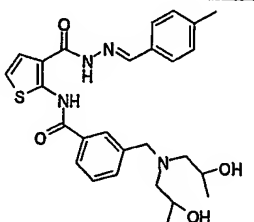
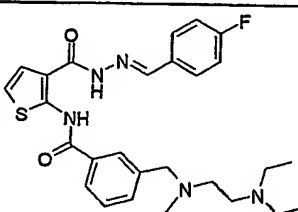
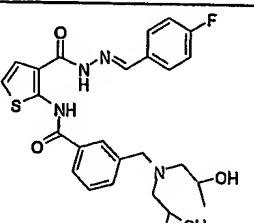
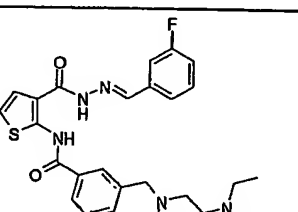
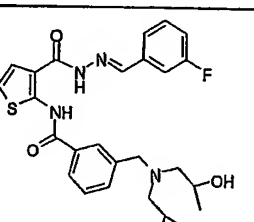
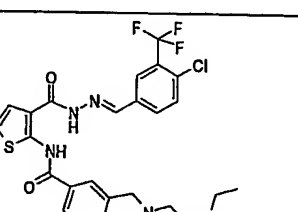
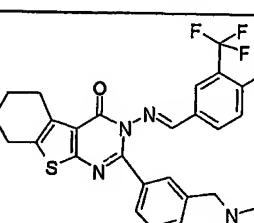
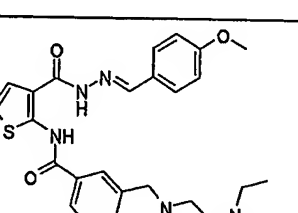
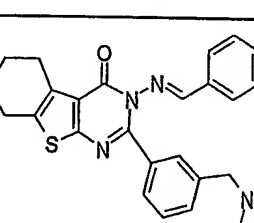
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物616		化合物622	
化合物617		化合物623	
化合物618		化合物624	
化合物619		化合物625	
化合物620		化合物626	
化合物621		化合物627	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物628		化合物634	
化合物629		化合物635	
化合物630		化合物636	
化合物631		化合物637	
化合物632		化合物638	
化合物633		化合物639	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物640		化合物646	
化合物641		化合物647	
化合物642		化合物648	
化合物643		化合物649	
化合物644		化合物650	
化合物645		化合物651	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物652		化合物658	
化合物653		化合物659	
化合物654		化合物660	
化合物655		化合物661	
化合物656		化合物662	
化合物657		化合物663	

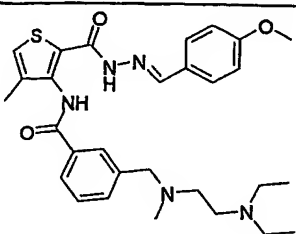
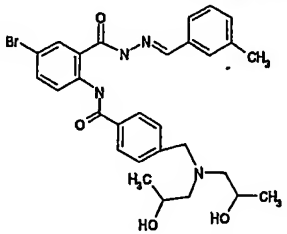
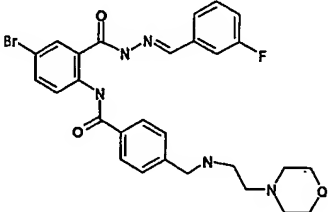
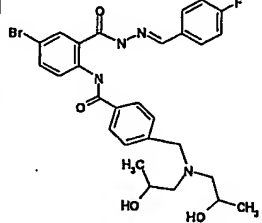
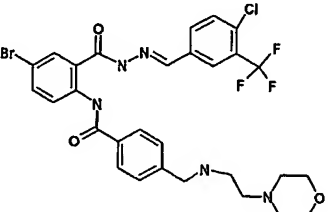
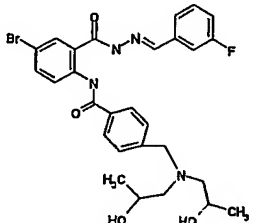
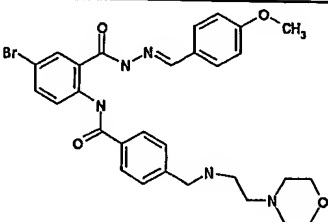
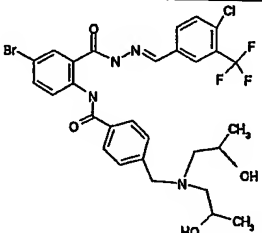
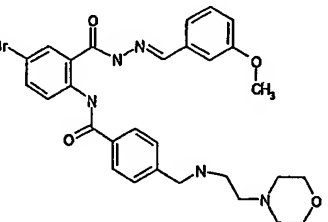
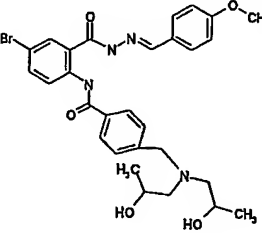
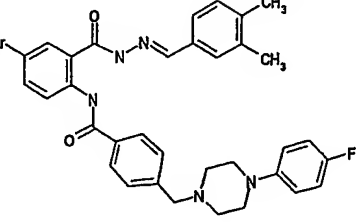
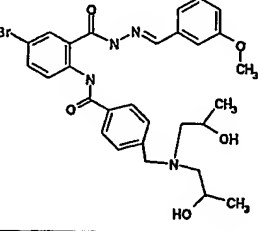


化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物664		化合物670	
化合物665		化合物671	
化合物666		化合物672	
化合物667		化合物673	
化合物668		化合物674	
化合物669		化合物675	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物676		化合物682	
化合物677		化合物683	
化合物678		化合物684	
化合物679		化合物685	
化合物680		化合物686	
化合物681		化合物687	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物688		化合物694	
化合物689		化合物695	
化合物690		化合物696	
化合物691		化合物697	
化合物692		化合物698	
化合物693		化合物699	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物700		化合物706	
化合物701		化合物707	
化合物702		化合物708	
化合物703		化合物709	
化合物704		化合物710	
化合物705		化合物711	

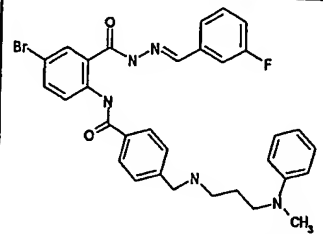
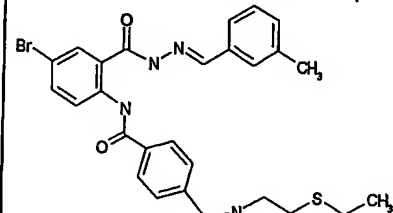
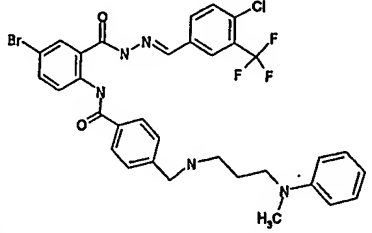
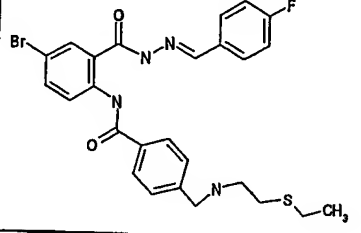
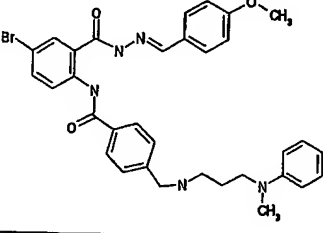
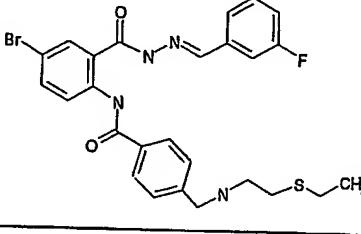
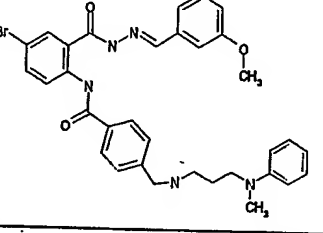
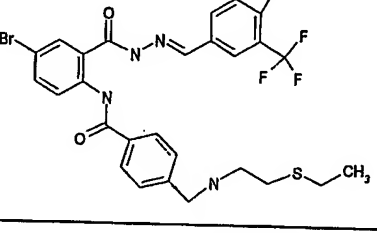
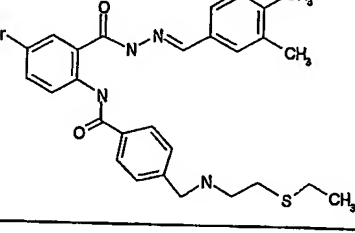
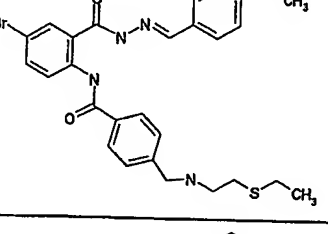
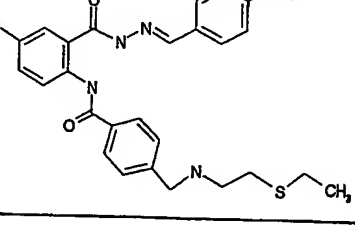
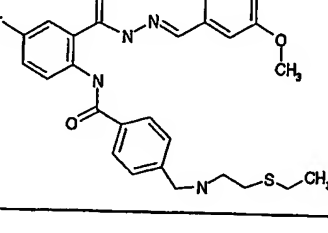
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物712		化合物718	
化合物713		化合物719	
化合物714		化合物720	
化合物715		化合物721	
化合物716		化合物722	
化合物717		化合物723	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物724		化合物730	
化合物725		化合物731	
化合物726		化合物732	
化合物727		化合物733	
化合物728		化合物734	
化合物729		化合物735	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物736		化合物742	
化合物737		化合物743	
化合物738		化合物744	
化合物739		化合物745	
化合物740		化合物746	
化合物741		化合物747	

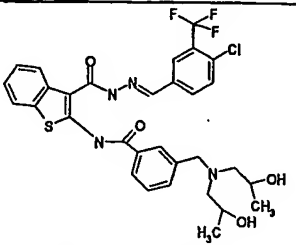
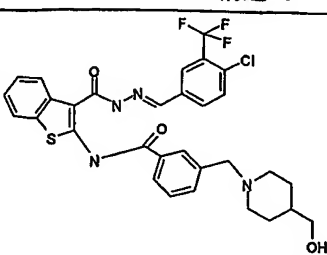
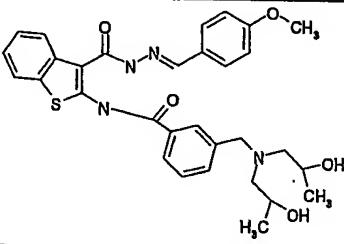
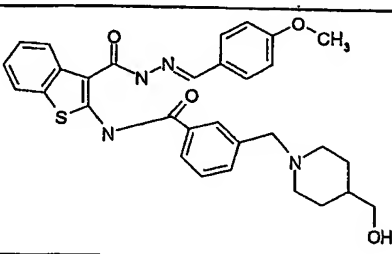
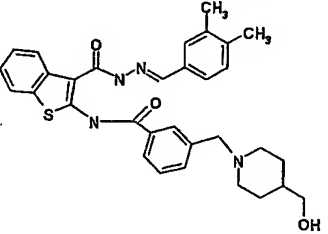
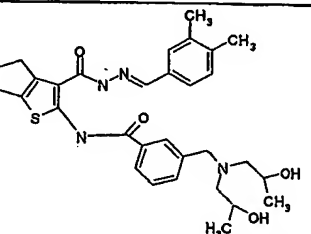
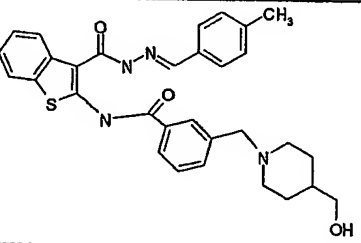
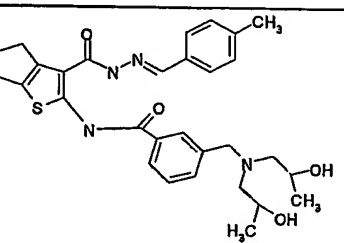
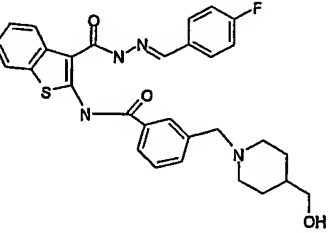
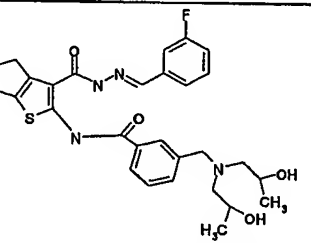
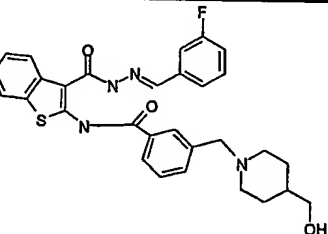
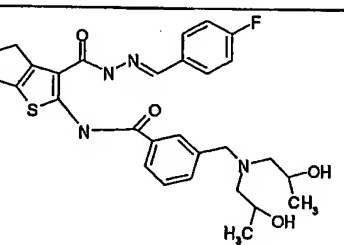
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物748		化合物754	
化合物749		化合物755	
化合物750		化合物756	
化合物751		化合物757	
化合物752		化合物758	
化合物753		化合物759	

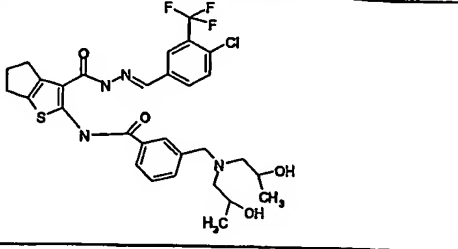
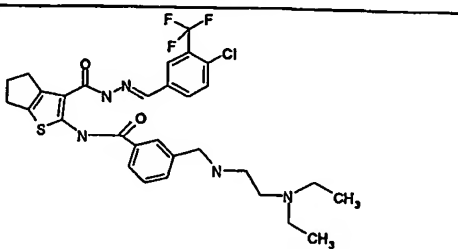
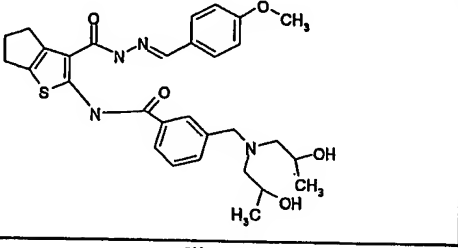
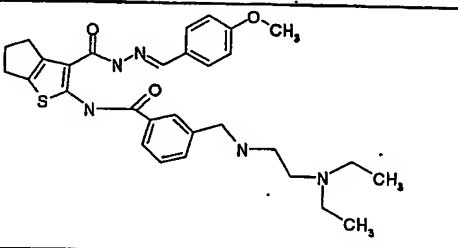
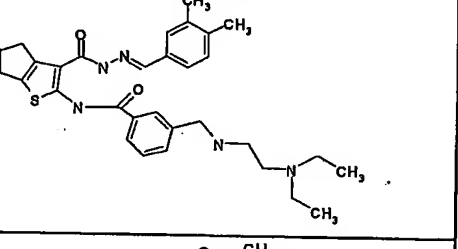
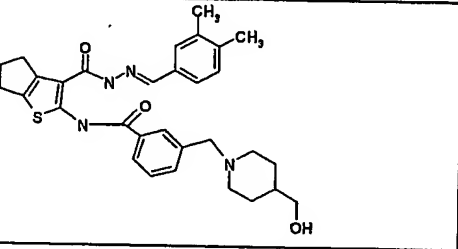
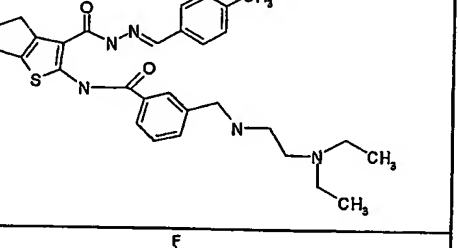
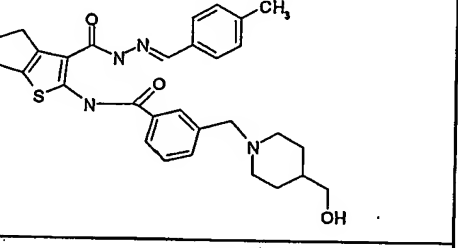
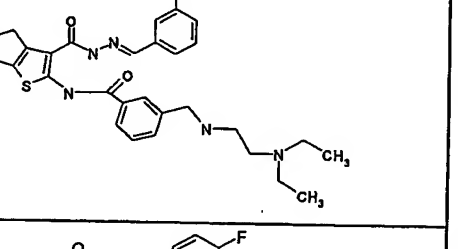
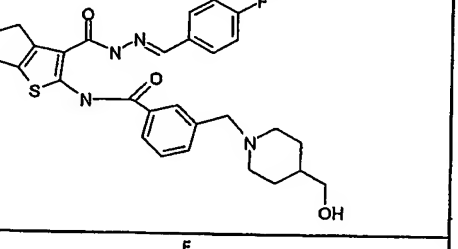
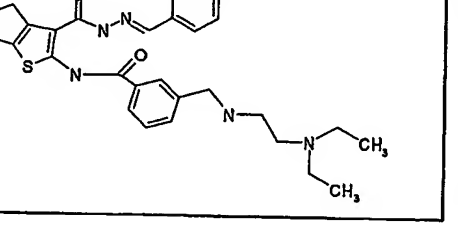
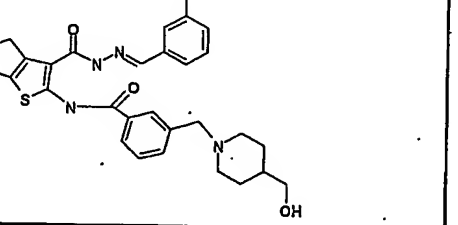


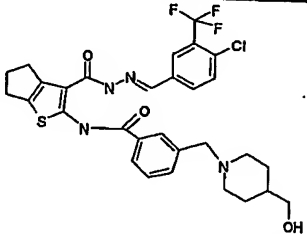
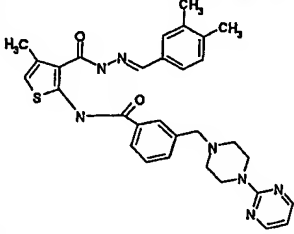
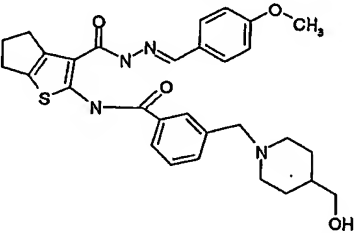
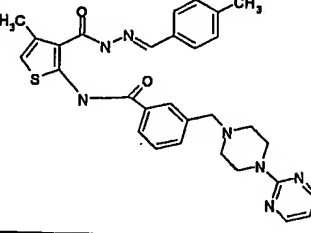
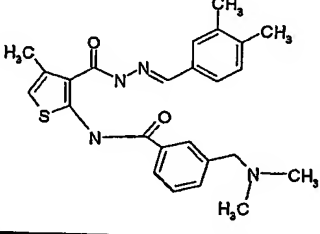
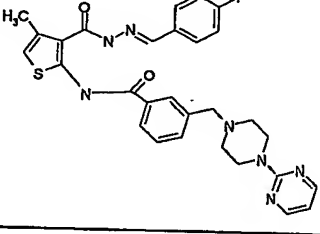
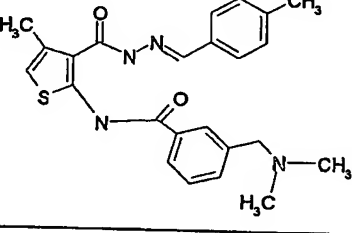
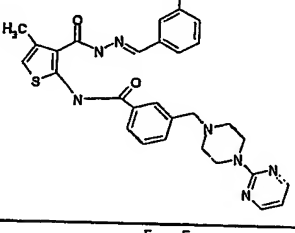
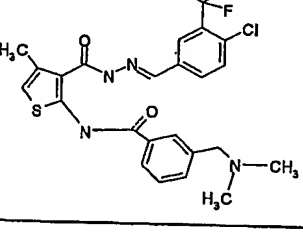
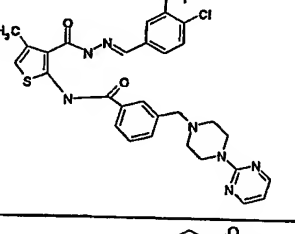
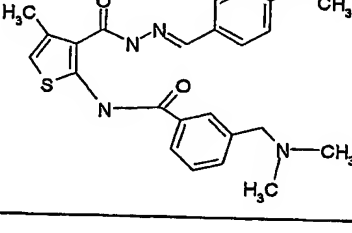
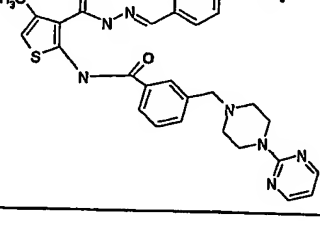
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物760		化合物766	
化合物761		化合物767	
化合物762		化合物768	
化合物763		化合物769	
化合物764		化合物770	
化合物765		化合物771	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物772		化合物778	
化合物773		化合物779	
化合物774		化合物780	
化合物775		化合物781	
化合物776		化合物782	
化合物777		化合物783	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物784		化合物790	
化合物785		化合物791	
化合物786		化合物792	
化合物787		化合物793	
化合物788		化合物794	
化合物789		化合物795	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物796		化合物802	
化合物797		化合物803	
化合物798		化合物804	
化合物799		化合物805	
化合物800		化合物806	
化合物801		化合物807	

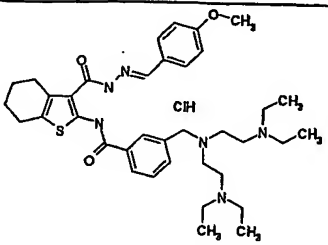
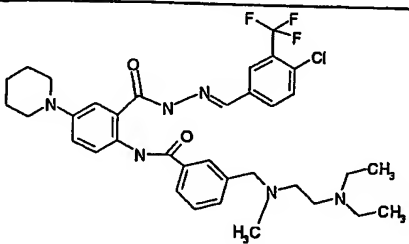
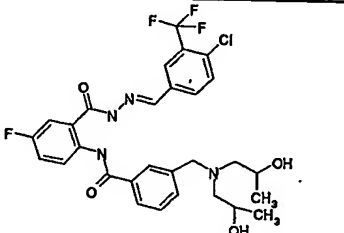
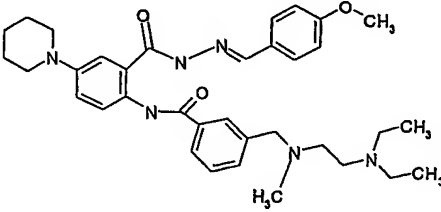
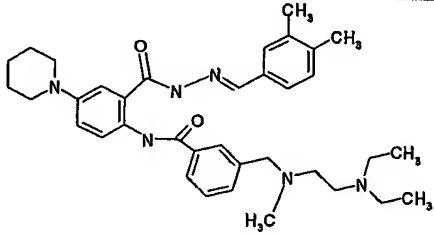
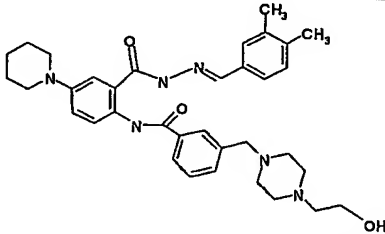
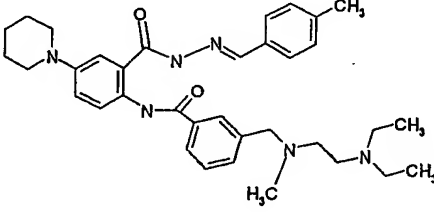
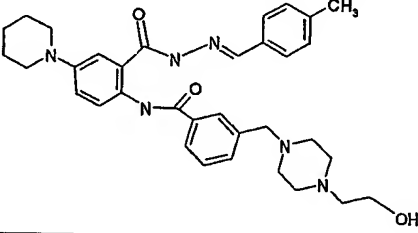
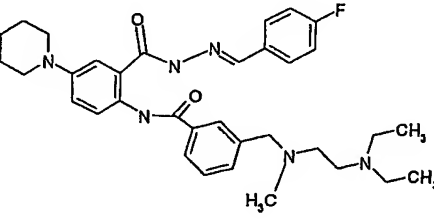
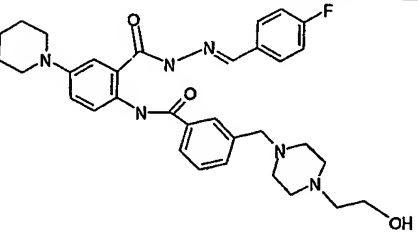
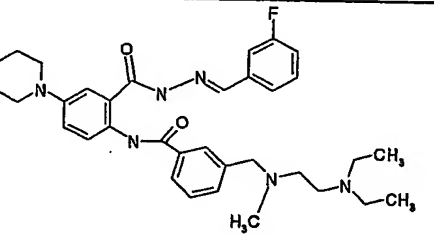
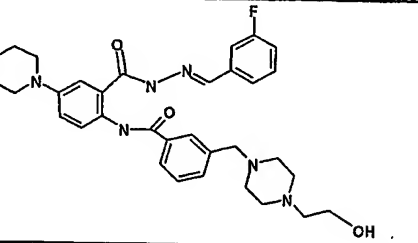
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物808		化合物814	
化合物809		化合物815	
化合物810		化合物816	
化合物811		化合物817	
化合物812		化合物818	
化合物813		化合物819	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物820		化合物826	
化合物821		化合物827	
化合物822		化合物828	
化合物823		化合物829	
化合物824		化合物830	
化合物825		化合物831	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物832		化合物838	
化合物833		化合物839	
化合物834		化合物840	
化合物835		化合物841	
化合物836		化合物842	
化合物837		化合物843	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物844		化合物850	
化合物845		化合物851	
化合物846		化合物852	
化合物847		化合物853	
化合物848		化合物854	
化合物849		化合物855	



化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物856		化合物862	
化合物857		化合物863	
化合物858		化合物864	
化合物859		化合物865	
化合物860		化合物866	
化合物861		化合物867	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物868		化合物874	
化合物869		化合物875	
化合物870		化合物876	
化合物871		化合物877	
化合物872		化合物878	
化合物873		化合物879	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物880		化合物886	
化合物881		化合物887	
化合物882		化合物888	
化合物883		化合物889	
化合物884		化合物890	
化合物885		化合物891	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物892		化合物898	
化合物893		化合物899	
化合物894		化合物900	
化合物895		化合物901	
化合物896		化合物902	
化合物897		化合物903	

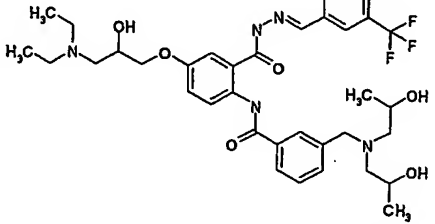
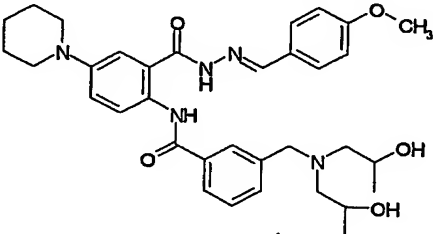
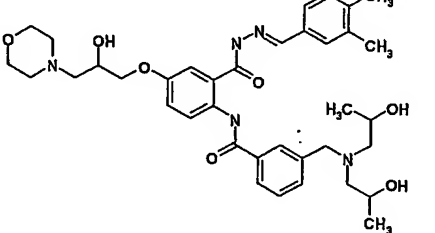
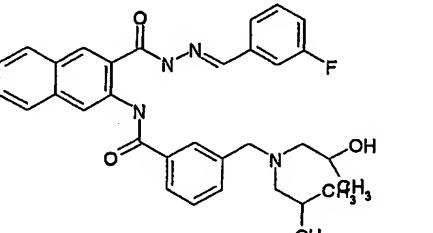
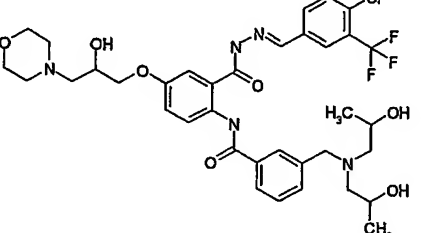
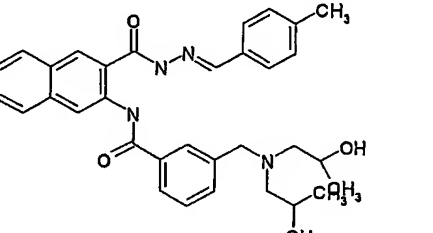
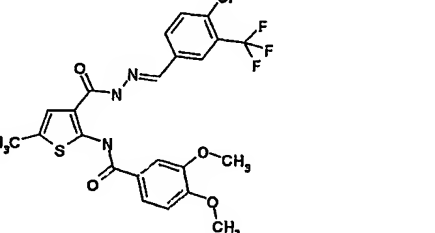
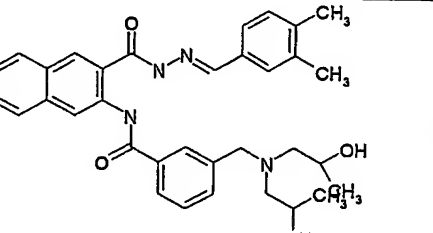
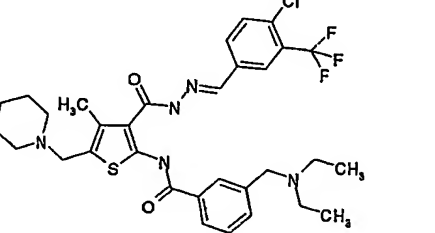
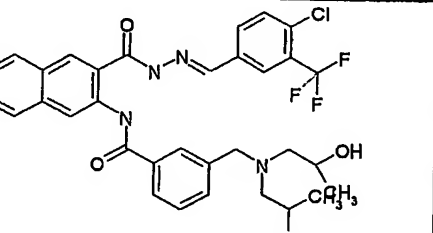
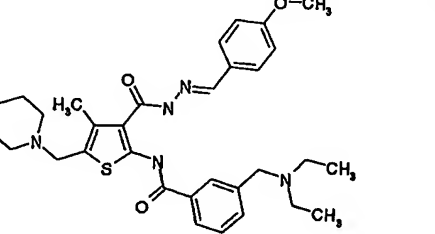
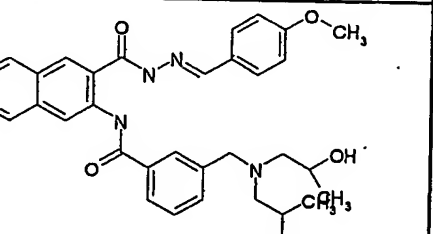
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物904		化合物910	
化合物905		化合物911	
化合物906		化合物912	
化合物907		化合物913	
化合物908		化合物914	
化合物909		化合物915	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物916		化合物922	
化合物917		化合物923	
化合物918		化合物924	
化合物919		化合物925	
化合物920		化合物926	
化合物921		化合物927	

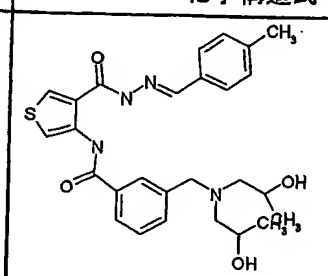
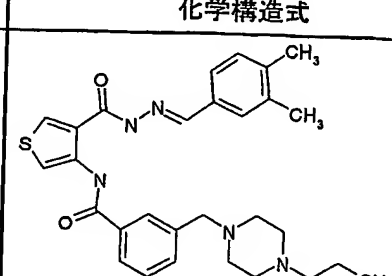
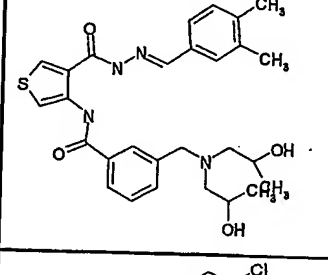
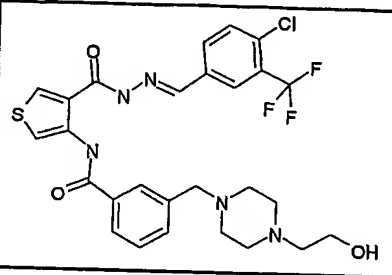
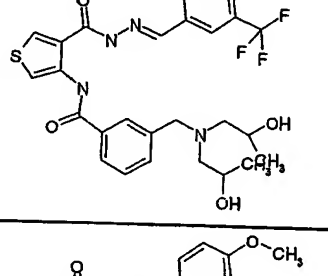
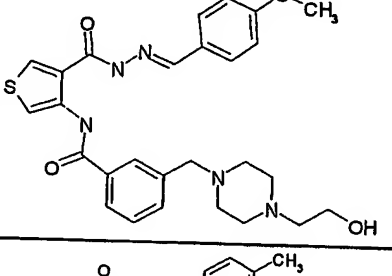
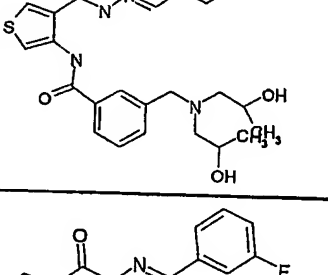
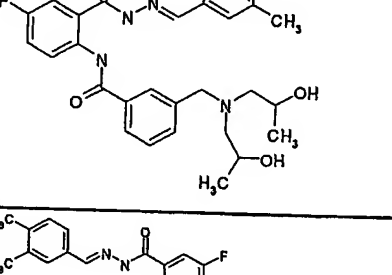
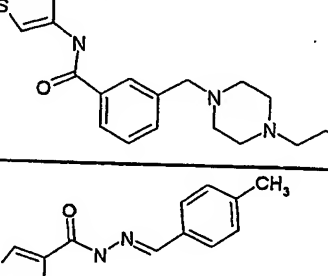
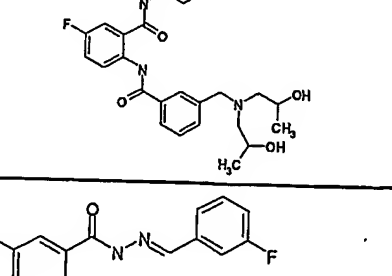
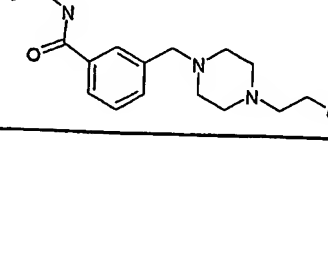
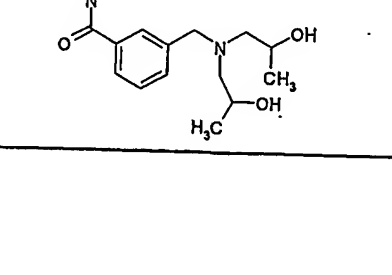
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物928		化合物934	
化合物929		化合物935	
化合物930		化合物936	
化合物931		化合物937	
化合物932		化合物938	
化合物933		化合物939	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物940		化合物946	
化合物941		化合物947	
化合物942		化合物948	
化合物943		化合物949	
化合物944		化合物950	
化合物945		化合物951	



化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物952		化合物958	
化合物953		化合物959	
化合物954		化合物960	
化合物955		化合物961	
化合物956		化合物962	
化合物957		化合物963	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物964		化合物970	
化合物965		化合物971	
化合物966		化合物972	
化合物967		化合物973	
化合物968		化合物974	
化合物969		化合物975	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物976		化合物982	
化合物977		化合物983	
化合物978		化合物984	
化合物979		化合物985	
化合物980		化合物986	
化合物981		化合物987	

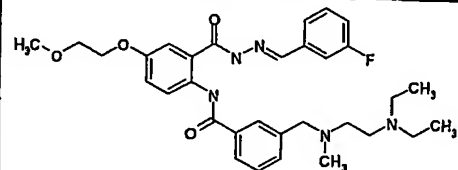
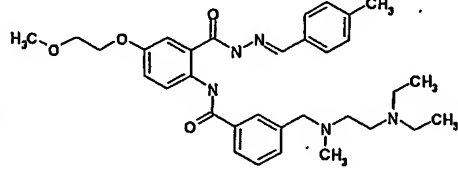
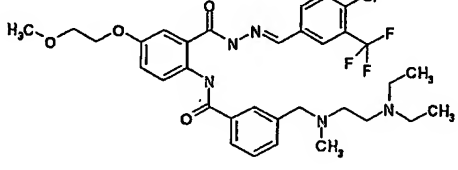
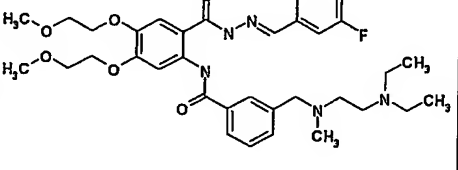
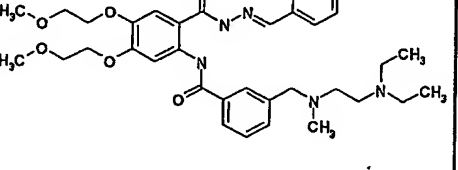
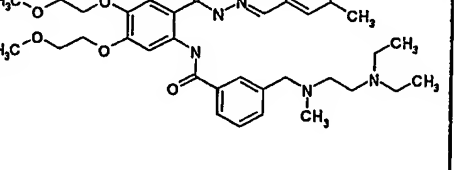
化合物 番号	化学構造式
化合物988	
化合物989	
化合物990	
化合物991	
化合物992	
化合物993	

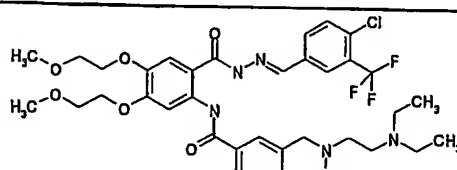
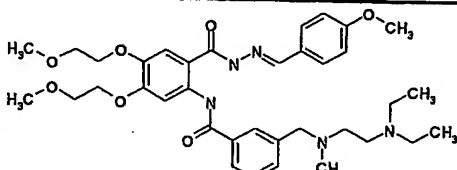
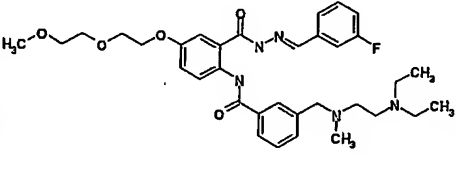
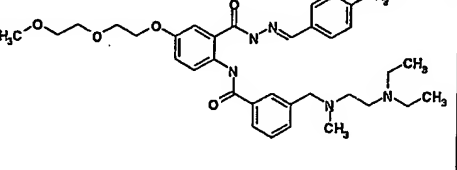
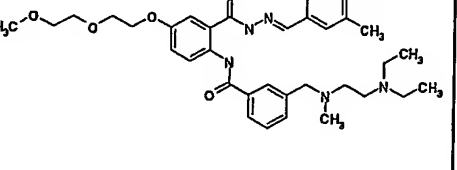
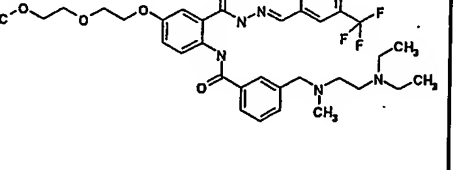
化合物 番号	化学構造式
化合物995	
化合物996	
化合物997	
化合物998	
化合物999	
化合物1000	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物1001		化合物1007	
化合物1002		化合物1008	
化合物1003		化合物1009	
化合物1004		化合物1010	
化合物1005		化合物1011	
化合物1006		化合物1012	

化合物 番号	化学構造式
化合物1013	
化合物1014	
化合物1015	
化合物1016	
化合物1017	
化合物1018	

化合物 番号	化学構造式
化合物1019	
化合物1020	
化合物1021	
化合物1022	
化合物1023	
化合物1024	

化合物 番号	化学構造式
化合物1025	
化合物1026	
化合物1027	
化合物1028	
化合物1029	
化合物1030	

化合物 番号	化学構造式
化合物1031	
化合物1032	
化合物1033	
化合物1034	
化合物1035	
化合物1036	

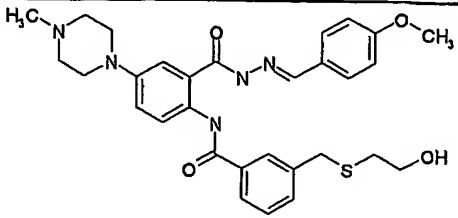
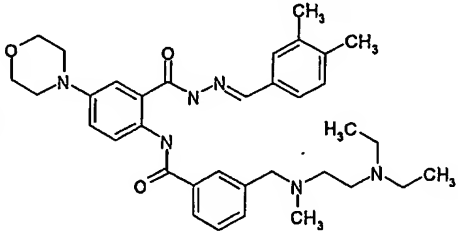
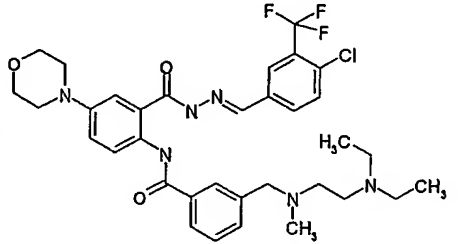
化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物1037		化合物1043	
化合物1038		化合物1044	
化合物1039		化合物1045	
化合物1040		化合物1046	
化合物1041		化合物1047	
化合物1042		化合物1048	

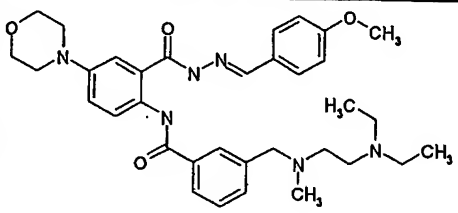
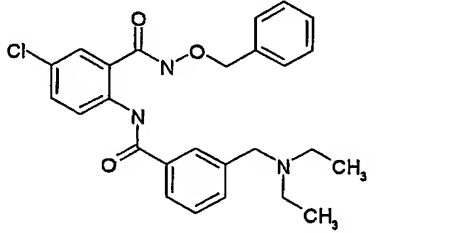


化合物 番号	化学構造式
化合物1049	
化合物1050	
化合物1051	
化合物1052	
化合物1053	
化合物1054	

化合物 番号	化学構造式
化合物1055	
化合物1056	
化合物1057	
化合物1058	
化合物1059	
化合物1060	

化合物 番号	化学構造式	化合物 番号	化学構造式
化合物1061		化合物1067	
化合物1062		化合物1068	
化合物1063		化合物1069	
化合物1064		化合物1070	
化合物1065		化合物1071	
化合物1066		化合物1072	

化合物 番号	化学構造式
化合物1073	
化合物1074	
化合物1075	

化合物 番号	化学構造式
化合物1076	
化合物1077	

### 薬理試験例 1 : N a P i - 2 b を発現させたアフリカツメガエル卵母細胞のナトリウム依存性のリン酸取り込み実験

Hilfiker H. et. al., Pro Natl Acad Sci USA, 95(24):14564-14569, 1998 に示されたマウス N a P i - 2 b と、Magagnin S. et. al., Proc Natl Aca Sci USA, 90(13):5979-5983, 1993 に示されたヒトおよびラット N a P i - 2 a の配列より縮重プライマー (degenerate primer) を作製し、ラット小腸より R N A を抽出し (ISOGEN 日本国 ニッポンジーン社製使用)、c D N A 合成キット (米国 STRATAGENE 社製) にて作製した c D N A ライブラリーを鋳型に用いて、P C R 法にて 4 0 0 b p の遺伝子断片を取得した。その後、得られた遺伝子断片をプローブに前記ラット小腸 c D N A ライブラリーをスクリーニングし、ラット N a P i - 2 b の全長遺伝子配列をクローニングした。クローニングしたラット N a P i - 2 b c D N A より、c R N A 合成キット (米国 Ambion 社製) にて c R N A を合成した。合成 c R N A はアフリカツメガエル卵母細胞 (日本国 コパセティック社より入手) に微量液体注入装置 (米国 Drummond 社製) にて注入し、2 日間培養することによりラット N a P i - 2 b を発現させた。その後、同アフリカツメガエル卵母細胞を用いて誘導体群のリン取り込み阻害活性を  $^{32}$ P 放射性リン (日本国 第一化学社製) を用いて測定したところ、同化合物は表 4 に示すような  $I C_{50}$  値をもって阻害活性を示した。 $I C_{50}$  値の算出に関しては、化合物の 5 つの濃度より得られた阻害活性値より最少二乗法を用いた近似式で阻害曲線を求め、最大阻害活性の 5 0 % を示す化合物の濃度を求めた。また、同様の阻害曲線より、3 0 0  $\mu$  M および 1 0 0  $\mu$  M における阻害活性を阻害率 (%) で表 5 に示した。

表 4

化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物1	9.11	化合物36	4.04	化合物70	9.51
化合物3	7.15	化合物37	13.47	化合物71	12.33
化合物4	79.93	化合物38	5.64	化合物72	10.41
化合物5	3.31	化合物39	9.24	化合物73	1.75
化合物6	5.38	化合物40	2.03	化合物74	2.15
化合物7	7.15	化合物41	2.43	化合物75	12.77
化合物8	1.72	化合物42	8.21	化合物76	13.17
化合物9	4.26	化合物43	20.66	化合物77	3.01
化合物10	26.12	化合物44	4.71	化合物78	7.17
化合物11	8.21	化合物45	26.14	化合物79	2.87
化合物12	4.51	化合物46	7.41	化合物80	10.87
化合物13	9.22	化合物47	4.38	化合物81	5.65
化合物14	12.10	化合物48	2.07	化合物82	6.03
化合物15	1.41	化合物49	3.37	化合物83	2.98
化合物16	2.30	化合物50	19.48	化合物84	8.42
化合物17	3.59	化合物51	4.60	化合物85	2.00
化合物18	4.03	化合物52	10.39	化合物86	11.4
化合物19	8.16	化合物53	4.05	化合物87	0.29
化合物20	2.83	化合物54	6.45	化合物88	0.22
化合物21	21.53	化合物55	0.86	化合物89	1.11
化合物22	26.67	化合物56	0.89	化合物90	3.42
化合物23	9.88	化合物57	1.02	化合物91	0.22
化合物24	20.92	化合物58	7.67	化合物92	0.26
化合物25	23.91	化合物59	1.22	化合物93	10.98
化合物26	25.37	化合物60	1.58	化合物94	5.63
化合物27	3.63	化合物61	0.31	化合物95	1.27
化合物28	5.12	化合物62	0.90	化合物96	5.94
化合物29	0.55	化合物63	5.97	化合物97	0.51
化合物30	7.86	化合物64	3.77	化合物98	0.62
化合物31	0.58	化合物65	1.29	化合物99	3.03
化合物32	1.95	化合物66	0.89	化合物100	0.64
化合物33	15.02	化合物67	0.65	化合物101	0.75
化合物34	1.50	化合物68	0.36	化合物102	5.58
化合物35	3.23	化合物69	3.93	化合物103	5.73

化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物104	11.34	化合物140	74.24	化合物175	3.57
化合物105	7.29	化合物141	5.78	化合物176	4.10
化合物106	5.11	化合物142	9.20	化合物177	26.01
化合物107	1.08	化合物143	5.88	化合物178	7.54
化合物108	3.83	化合物144	5.02	化合物179	18.69
化合物109	6.18	化合物145	3.82	化合物180	<3.00
化合物110	7.70	化合物146	1.99	化合物181	3.16
化合物111	9.12	化合物147	7.68	化合物182	10.24
化合物112	41.98	化合物148	15.63	化合物183	<3.00
化合物113	17.91	化合物149	5.51	化合物184	4.01
化合物114	2.55	化合物150	1.09	化合物185	2.02
化合物115	5.48	化合物151	3.07	化合物186	10.1
化合物116	7.01	化合物152	1.48	化合物187	7.87
化合物117	0.58	化合物153	3.50	化合物188	19.43
化合物118	6.07	化合物154	2.37	化合物189	1.47
化合物119	0.74	化合物155	0.32	化合物190	20.32
化合物120	2.55	化合物156	0.46	化合物191	12.12
化合物121	4.06	化合物157	7.19	化合物192	23.09
化合物122	<3.00	化合物158	3.28	化合物193	4.21
化合物123	3.77	化合物159	4.35	化合物194	7.36
化合物124	3.15	化合物160	0.93	化合物195	0.98
化合物125	136.43	化合物161	0.96	化合物196	0.61
化合物126	6.43	化合物162	3.11	化合物197	4.87
化合物127	11.59	化合物163	1.60	化合物198	2.71
化合物128	11.61	化合物164	4.76	化合物199	1.82
化合物129	13.70	化合物165	2.43	化合物200	0.39
化合物130	11.42	化合物166	27.85	化合物201	11.10
化合物132	0.75	化合物167	30.20	化合物202	3.14
化合物133	0.88	化合物168	4.84	化合物203	<3.00
化合物134	7.82	化合物169	4.24	化合物204	<3.00
化合物135	3.74	化合物170	5.34	化合物205	<3.00
化合物136	4.52	化合物171	5.12	化合物206	<3.00
化合物137	3.00	化合物172	2.74	化合物207	<1.00
化合物138	4.47	化合物173	7.40	化合物208	<0.30
化合物139	55.50	化合物174	12.54	化合物209	<1.00

化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物210	34.96	化合物268	1.02	化合物303	1.13
化合物211	69.07	化合物269	2.19	化合物304	1.23
化合物212	71.27	化合物270	5.04	化合物305	2.47
化合物213	16.64	化合物271	0.21	化合物306	2.13
化合物214	3.95	化合物272	0.47	化合物307	41.17
化合物215	<3.00	化合物273	0.15	化合物308	2.76
化合物216	21.82	化合物274	1.04	化合物309	15.12
化合物217	11.21	化合物275	1.73	化合物310	7.82
化合物218	4.05	化合物276	6.20	化合物311	7.78
化合物219	9.07	化合物277	1.60	化合物312	3.31
化合物220	9.42	化合物278	0.16	化合物313	1.24
化合物221	9.51	化合物279	2.31	化合物314	3.39
化合物222	8.86	化合物280	0.78	化合物315	9.02
化合物223	11.30	化合物281	4.60	化合物316	4.71
化合物224	19.99	化合物282	6.71	化合物317	5.02
化合物225	60.98	化合物283	22.44	化合物318	2.49
化合物226	1.69	化合物284	26.94	化合物319	9.76
化合物227	7.40	化合物285	0.90	化合物320	4.09
化合物228	22.48	化合物286	0.57	化合物321	2.66
化合物229	6.32	化合物287	0.11	化合物322	5.93
化合物252	1.49	化合物288	1.31	化合物323	4.69
化合物253	3.47	化合物289	2.89	化合物324	4.43
化合物255	3.54	化合物290	3.25	化合物325	2.56
化合物256	<10.00	化合物291	1.16	化合物326	2.10
化合物257	<3.00	化合物292	3.50	化合物327	5.12
化合物258	<3.00	化合物293	5.59	化合物328	1.15
化合物259	<3.00	化合物294	7.80	化合物329	5.63
化合物260	<3.00	化合物295	7.58	化合物330	10.69
化合物261	<3.00	化合物296	1.45	化合物331	15.76
化合物262	1.10	化合物297	0.96	化合物332	2.87
化合物263	<1.00	化合物298	9.22	化合物333	17.18
化合物264	<1.00	化合物299	3.91	化合物334	7.69
化合物265	<1.00	化合物300	1.92	化合物335	5.86
化合物266	<1.00	化合物301	15.17	化合物336	16.63
化合物267	0.43	化合物302	1.12	化合物337	1.39

化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物338	18.97	化合物377	9.65	化合物412	7.96
化合物339	12.77	化合物378	4.35	化合物413	<3.00
化合物340	8.41	化合物379	0.97	化合物414	<3.00
化合物341	<3.00	化合物380	0.35	化合物415	<3.00
化合物342	32.60	化合物381	1.00	化合物416	3.25
化合物343	124.10	化合物382	1.04	化合物417	<3.00
化合物344	30.99	化合物383	1.98	化合物418	9.38
化合物345	129.95	化合物384	0.25	化合物419	9.20
化合物346	4.46	化合物385	0.31	化合物420	27.14
化合物347	4.91	化合物386	<3.00	化合物421	29.56
化合物348	16.59	化合物387	6.45	化合物422	1.15
化合物349	8.78	化合物388	19.67	化合物423	<3.00
化合物350	25.32	化合物389	1.09	化合物424	1.79
化合物351	8.96	化合物390	0.45	化合物425	<3.00
化合物352	13.00	化合物391	1.02	化合物426	1.89
化合物353	8.85	化合物392	1.42	化合物427	<3.00
化合物354	1.54	化合物393	0.52	化合物428	1.82
化合物356	0.17	化合物394	0.95	化合物429	5.88
化合物358	54.07	化合物395	8.55	化合物430	4.53
化合物359	7.10	化合物396	8.19	化合物431	5.57
化合物360	0.63	化合物397	9.25	化合物432	22.22
化合物361	<1.00	化合物398	<0.30	化合物433	14.34
化合物362	<1.00	化合物399	3.67	化合物434	7.78
化合物363	<1.00	化合物400	<0.30	化合物435	7.65
化合物364	<1.00	化合物401	6.13	化合物436	8.36
化合物367	6.88	化合物402	14.12	化合物437	<3.00
化合物368	1.37	化合物403	26.73	化合物438	26.27
化合物369	1.45	化合物404	2.18	化合物439	28.74
化合物370	1.86	化合物405	1.90	化合物440	32.35
化合物371	2.54	化合物406	0.88	化合物441	40.14
化合物372	0.80	化合物407	0.57	化合物442	3.15
化合物373	1.68	化合物408	0.69	化合物443	11.05
化合物374	9.25	化合物409	2.52	化合物444	<3.00
化合物375	24.71	化合物410	4.05	化合物445	10.33
化合物376	21.00	化合物411	10.08	化合物446	1.54



化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物447	2.16	化合物483	<3.00	化合物518	1.52
化合物448	9.41	化合物484	<3.00	化合物519	1.72
化合物449	21.73	化合物485	<3.00	化合物521	1.24
化合物450	16.94	化合物486	<3.00	化合物522	1.09
化合物451	37.84	化合物487	<3.00	化合物551	0.47
化合物452	<3.00	化合物488	<3.00	化合物552	2.63
化合物453	<3.00	化合物489	<3.00	化合物553	2.80
化合物454	<3.00	化合物490	<3.00	化合物554	1.46
化合物455	<3.00	化合物491	<3.00	化合物555	<3.00
化合物456	<3.00	化合物492	<3.00	化合物556	<3.00
化合物457	<3.00	化合物493	<3.00	化合物557	<0.30
化合物458	<3.00	化合物494	2.07	化合物558	1.07
化合物459	<3.00	化合物495	0.35	化合物559	1.26
化合物460	<3.00	化合物496	0.64	化合物560	1.09
化合物461	3.59	化合物497	0.51	化合物561	0.31
化合物462	<3.00	化合物498	0.60	化合物562	<1.00
化合物463	4.44	化合物499	0.98	化合物563	<1.00
化合物464	5.00	化合物500	0.35	化合物564	11.57
化合物465	7.43	化合物501	23.13	化合物565	12.98
化合物466	<3.00	化合物502	15.68	化合物566	14.58
化合物467	7.94	化合物503	10.35	化合物567	<1.00
化合物468	22.45	化合物504	18.93	化合物568	4.32
化合物469	33.16	化合物505	1.21	化合物569	<3.00
化合物470	23.54	化合物506	19.5	化合物570	6.04
化合物472	<3.00	化合物507	1.86	化合物571	5.27
化合物473	<3.00	化合物508	0.48	化合物572	4.12
化合物474	<3.00	化合物509	13.59	化合物573	1.75
化合物475	<3.00	化合物510	1.48	化合物574	6.93
化合物476	<3.00	化合物511	2.16	化合物575	<3.00
化合物477	<3.00	化合物512	28.30	化合物576	<3.00
化合物478	<3.00	化合物513	15.96	化合物577	<3.00
化合物479	<3.00	化合物514	2.15	化合物578	<3.00
化合物480	<3.00	化合物515	1.90	化合物579	<3.00
化合物481	12.10	化合物516	2.13	化合物580	<3.00
化合物482	<3.00	化合物517	1.71	化合物581	<3.00

化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物582	<3.00	化合物617	3.68	化合物652	0.72
化合物583	<3.00	化合物618	4.25	化合物653	1.10
化合物584	<3.00	化合物619	<3.00	化合物654	2.03
化合物585	<3.00	化合物620	3.58	化合物655	1.58
化合物586	<3.00	化合物621	<3.00	化合物656	2.98
化合物587	<3.00	化合物622	<3.00	化合物657	2.63
化合物588	9.33	化合物623	<3.00	化合物658	<3.00
化合物589	<3.00	化合物624	<3.00	化合物659	12.45
化合物590	6.18	化合物625	<3.00	化合物660	18.70
化合物591	1.01	化合物626	<3.00	化合物661	<10.00
化合物592	11.94	化合物627	<1.00	化合物662	3.20
化合物593	<3.00	化合物628	1.29	化合物663	136.67
化合物594	3.60	化合物629	3.01	化合物664	15.08
化合物595	3.87	化合物630	<1.00	化合物666	31.23
化合物596	5.47	化合物631	<1.00	化合物667	30.49
化合物597	1.47	化合物632	<1.00	化合物668	9.13
化合物598	53.04	化合物633	1.19	化合物669	15.29
化合物599	<3.00	化合物634	1.74	化合物671	<3.00
化合物600	3.84	化合物635	1.56	化合物672	31.18
化合物601	<3.00	化合物636	3.89	化合物673	10.13
化合物602	3.98	化合物637	<1.00	化合物675	<3.00
化合物603	<3.00	化合物638	3.15	化合物676	<3.00
化合物604	9.23	化合物639	1.84	化合物677	<3.00
化合物605	0.95	化合物640	1.61	化合物678	<3.00
化合物606	1.01	化合物641	2.92	化合物679	<3.00
化合物607	0.43	化合物642	2.14	化合物680	4.04
化合物608	<0.30	化合物643	3.68	化合物681	25.90
化合物609	<0.30	化合物644	5.91	化合物682	12.50
化合物610	1.82	化合物645	<3.00	化合物683	<3.00
化合物611	2.16	化合物646	1.77	化合物684	54.25
化合物612	2.34	化合物647	5.62	化合物685	36.43
化合物613	1.41	化合物648	2.04	化合物686	<3.00
化合物614	3.29	化合物649	2.69	化合物687	<3.00
化合物615	2.08	化合物650	0.95	化合物688	<3.00
化合物616	13.86	化合物651	262.90	化合物689	<3.00

化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物690	87.97	化合物751	13.11	化合物809	5.22
化合物691	97.03	化合物752	<3.00	化合物810	6.68
化合物692	99.40	化合物753	12.36	化合物811	9.11
化合物693	70.18	化合物754	<3.00	化合物812	5.58
化合物694	38.77	化合物756	10.33	化合物813	6.25
化合物695	6.76	化合物757	18.84	化合物814	<3.00
化合物696	4.47	化合物763	11.18	化合物815	16.74
化合物697	<3.00	化合物764	5.92	化合物816	14.77
化合物698	<3.00	化合物765	6.88	化合物817	36.14
化合物713	15.49	化合物768	10.62	化合物818	7.38
化合物714	3.52	化合物769	4.44	化合物819	5.95
化合物718	6.91	化合物770	16.49	化合物820	17.86
化合物719	9.59	化合物786	1.33	化合物821	17.86
化合物720	3.51	化合物787	1.69	化合物822	5.90
化合物721	22.34	化合物788	2.04	化合物823	6.93
化合物722	12.84	化合物789	1.16	化合物824	3.22
化合物723	18.03	化合物790	4.32	化合物825	4.52
化合物724	17.08	化合物791	5.50	化合物826	4.44
化合物725	69.40	化合物792	1.26	化合物827	3.50
化合物726	<3.00	化合物793	1.41	化合物828	9.33
化合物728	20.33	化合物794	0.97	化合物829	3.91
化合物729	27.33	化合物795	1.92	化合物830	4.81
化合物730	15.66	化合物796	0.31	化合物831	3.88
化合物731	19.18	化合物797	3.39	化合物832	4.97
化合物732	29.35	化合物798	3.62	化合物833	7.89
化合物733	<10.00	化合物799	3.72	化合物834	19.02
化合物735	18.34	化合物800	9.24	化合物835	6.46
化合物737	4.24	化合物801	4.70	化合物836	0.77
化合物738	7.55	化合物802	1.20	化合物837	12.91
化合物743	14.40	化合物803	4.92	化合物838	<3.00
化合物745	6.12	化合物804	1.23	化合物839	5.04
化合物746	16.77	化合物805	4.76	化合物840	6.95
化合物747	11.93	化合物806	3.90	化合物841	<3.00
化合物749	9.05	化合物807	<1.00	化合物842	3.22
化合物750	<3.00	化合物808	1.97	化合物843	4.19

化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)	化合物番号	IC50( $\mu$ M)
化合物844	<3.00	化合物881	0.18	化合物918	1.55
化合物845	<3.00	化合物882	0.33	化合物919	0.31
化合物846	<3.00	化合物883	0.04	化合物920	<1.00
化合物847	<3.00	化合物884	0.95	化合物921	1.22
化合物848	2.20	化合物885	1.24	化合物922	2.89
化合物849	<3.00	化合物886	0.81	化合物923	18.79
化合物850	3.10	化合物887	1.75	化合物924	40.16
化合物851	1.36	化合物888	2.55	化合物925	25.50
化合物852	<1.00	化合物889	0.33	化合物926	<1.00
化合物853	2.14	化合物890	3.91	化合物927	<1.00
化合物854	1.33	化合物891	1.47	化合物928	<1.00
化合物855	1.75	化合物892	14.84	化合物929	<1.00
化合物856	1.77	化合物893	<0.30	化合物935	0.17
化合物857	1.18	化合物894	0.50	化合物936	5.59
化合物858	0.46	化合物895	<0.30	化合物937	137.00
化合物859	0.39	化合物896	<0.30	化合物938	1.41
化合物860	0.65	化合物897	<0.30	化合物939	<3.00
化合物861	0.52	化合物898	<0.30	化合物940	30.63
化合物862	0.35	化合物899	<1.00	化合物941	8.72
化合物863	1.22	化合物900	<1.00	化合物942	0.20
化合物864	0.74	化合物901	<1.00	化合物943	10.58
化合物865	1.49	化合物902	<1.00	化合物944	12.04
化合物866	1.92	化合物903	<1.00	化合物945	19.38
化合物867	2.24	化合物904	1.71	化合物947	30.19
化合物868	<0.30	化合物905	1.18	化合物948	11.62
化合物869	6.68	化合物906	1.83	化合物950	9.08
化合物870	0.53	化合物907	6.75	化合物952	19.24
化合物871	1.00	化合物908	13.16	化合物954	60.51
化合物872	<3.00	化合物909	1.02	化合物956	29.85
化合物873	0.66	化合物910	7.81	化合物958	<1.00
化合物874	<0.30	化合物911	<1.00	化合物959	<1.00
化合物875	5.20	化合物912	1.04	化合物960	1.12
化合物876	<3.00	化合物913	1.65	化合物961	<1.00
化合物877	<0.30	化合物914	1.75	化合物962	<1.00
化合物878	<0.30	化合物915	8.15	化合物963	<1.00
化合物879	3.72	化合物916	5.22	化合物965	27.22
化合物880	0.08	化合物917	1.25	化合物966	16.04

化合物番号	IC50(μM)	化合物番号	IC50(μM)	化合物番号	IC50(μM)
化合物967	6.57	化合物1018	0.92	化合物1059	0.43
化合物969	<3.00	化合物1019	0.41	化合物1060	0.44
化合物970	<3.00	化合物1020	0.39	化合物1061	1.99
化合物971	<3.00	化合物1021	5.57	化合物1062	6.76
化合物972	<3.00	化合物1022	3.23	化合物1064	<1.00
化合物973	<3.00	化合物1023	0.99	化合物1065	1.21
化合物974	12.56	化合物1024	3.94	化合物1066	2.69
化合物975	17.36	化合物1025	5.71	化合物1067	2.79
化合物976	10.73	化合物1026	3.86	化合物1069	<1.00
化合物977	10.15	化合物1027	1.20	化合物1070	<1.00
化合物980	13.80	化合物1028	29.07	化合物1071	<1.00
化合物981	12.17	化合物1029	34.73	化合物1072	3.88
化合物982	8.05	化合物1030	14.16	化合物1073	20.36
化合物983	8.31	化合物1033	18.66	化合物1074	1.54
化合物984	22.12	化合物1034	17.21	化合物1075	1.34
化合物985	<3.00	化合物1035	3.70	化合物1076	2.57
化合物986	28.95	化合物1036	1.50		
化合物987	<3.00	化合物1037	38.51		
化合物988	3.88	化合物1038	3.35		
化合物989	<3.00	化合物1039	2.76		
化合物990	<3.00	化合物1040	52.16		
化合物996	2.66	化合物1041	10.25		
化合物997	7.88	化合物1042	14.74		
化合物998	16.57	化合物1043	8.26		
化合物999	58.16	化合物1044	2.13		
化合物1001	<3.00	化合物1045	13.11		
化合物1002	2.58	化合物1046	<1.00		
化合物1003	9.12	化合物1047	<1.00		
化合物1006	6.31	化合物1048	<1.00		
化合物1007	0.40	化合物1049	<1.00		
化合物1008	0.30	化合物1050	1.42		
化合物1009	0.10	化合物1051	1.16		
化合物1010	0.24	化合物1052	1.33		
化合物1011	1.28	化合物1053	<1.00		
化合物1012	1.89	化合物1054	<1.00		
化合物1013	8.89	化合物1055	1.96		
化合物1015	11.07	化合物1056	1.88		
化合物1016	9.23	化合物1057	1.26		
化合物1017	0.87	化合物1058	1.07		

表 5

化合物番号	阻害(%) (300 $\mu$ M)	化合物番号	阻害(%) (300 $\mu$ M)
化合物2	77.30	化合物526	40.24
化合物131	32.40	化合物527	40.94
化合物230	50.42	化合物528	58.38
化合物231	32.76	化合物529	80.96
化合物232	44.92	化合物530	38.16
化合物233	33.62	化合物531	35.68
化合物234	37.88	化合物532	76.00
化合物235	47.92	化合物533	36.87
化合物236	49.42	化合物534	43.82
化合物237	33.12	化合物535	52.98
化合物238	30.58	化合物536	88.25
化合物239	59.08	化合物537	82.05
化合物240	37.92	化合物538	30.31
化合物241	46.94	化合物539	88.39
化合物242	37.61	化合物540	38.41
化合物243	50.17	化合物541	32.16
化合物244	30.72	化合物542	41.11
化合物245	31.68	化合物543	30.2
化合物246	32.62	化合物544	60.05
化合物247	34.81	化合物545	88.81
化合物248	30.30	化合物546	85.19
化合物249	41.59	化合物547	66.61
化合物250	37.86	化合物548	85.72
化合物251	31.22	化合物549	85.10
化合物357	65.82	化合物550	78.88
化合物366	69.87	化合物665	82.34
化合物471	50.99	化合物670	70.17
化合物523	50.09	化合物674	85.12
化合物524	42.75	化合物699	58.35
化合物525	38.89	化合物700	40.28

化合物番号	阻害(%) (300 $\mu$ M)
化合物701	53.98
化合物702	49.17
化合物703	57.92
化合物704	46.62
化合物705	44.68
化合物706	47.79
化合物707	41.22
化合物708	42.04
化合物709	59.36
化合物710	83.13
化合物711	81.04
化合物712	48.73
化合物715	84.11
化合物716	85.77
化合物717	53.54
化合物727	67.74
化合物734	64.91
化合物736	61.49
化合物739	58.89
化合物740	58.55
化合物741	50.93
化合物742	77.57
化合物744	83.71
化合物748	56.45
化合物755	67.27
化合物758	58.21
化合物759	63.85
化合物760	73.34
化合物761	46.24
化合物762	52.08
化合物766	81.89
化合物767	81.83

化合物番号	阻害(%) (300 $\mu$ M)
化合物771	85.12
化合物772	67.72
化合物773	53.91
化合物774	58.85
化合物775	44.62
化合物776	49.19
化合物777	34.17
化合物778	39.12
化合物779	51.64
化合物780	47.74
化合物781	51.18
化合物782	86.76
化合物783	88.84
化合物784	88.49
化合物785	39.53
化合物930	40.20
化合物931	31.22
化合物932	36.09
化合物933	37.62
化合物934	39.27
化合物946	45.00
化合物949	72.60
化合物951	68.51
化合物953	67.80
化合物955	57.67
化合物957	54.91
化合物964	67.50
化合物968	52.70
化合物978	74.08
化合物979	73.73
化合物991	30.11
化合物992	31.92

化合物番号	阻害(%) (300 $\mu$ M)
化合物993	39.71
化合物995	42.10
化合物1000	32.14
化合物1004	34.20
化合物1005	59.07
化合物1014	55.20
化合物1031	58.77
化合物1032	39.98
化合物1077	40.18

化合物番号	阻害(%) (100 $\mu$ M)
化合物1063	63.94
化合物1068	74.42



### 薬理試験例 2: ウサギ空腸刷子縁膜小胞のナトリウム依存性のリン酸取り込み実験

ニュージーランドホワイト雄ラビット7週令（日本国 北山ラベス社より入手）より空腸上皮を採取し、Kanaoka Katai et.al., J.Biochem. 121, 50-55, 1997、Peerce, B. E. et al., Biochemistry 26, 4272-4279, 1987に示されるカルシウム沈殿法にて刷子縁膜小胞を単離した。その後、同サンプルを用いてKanaoka Katai et.al., J.Biochem. 121, 50-55, 1997に示される急速ろ過法によって化合物29および化合物68のリン取り込み阻害活性を $^{32}\text{P}$ 放射性リン（日本国第一化学社製）を用いて測定したところ、それぞれの化合物は濃度依存的に阻害活性を示した（図1）。また、同一の実験においてグルコース吸収への非特異的阻害活性を14C-グルコース（米国 モラベックバイオケミカル社製）を用いて行ったが、本化合物は阻害活性を示さなかった（図2）。両実験において非特異的取り込みの陰性コントロールとして塩化カルウム添加群を置いた。なお、これ以下のすべての試験結果は平均値  $\pm$  標準誤差で表示した。対照群と被験化合物群の有意差検定にはスチューデントのt検定を用いた。

### 薬理試験例 3: NaPi-2aを発現させたアフリカツメガエル卵母細胞のナトリウム依存性のリン酸取り込み実験

Magagnin S. et.al., Proc Natl Aca Sci USA, 90(13):5979-5983, 1993に記載されるヒトNaPi-2aのcDNAをPCR法によりクローニングし、薬理試験例1と同様の方法でアフリカツメガエル卵母細胞にNaPi-2aを発現させて、リン取り込み阻害活性を $^{32}\text{P}$ 放射性リンを用いて測定した。その結果、化合物1は濃度依存的にNaPi-2aに対して阻害活性を示した（図3）。また化合物29はNaPi-2bのみならず、NaPi-2aに対しても阻害活性を示した（図4）。なお、非特異的取り込みの陰性コントロールとして塩化コリン（Choline Cl）添加群とリン酸輸送阻害の陽性コントロールとしてPFA（phosphonoformic acid）を置いた。

また、本発明による化合物は表6に示すような $\text{IC}_{50}$ 値をもって阻害活性を示した。 $\text{IC}_{50}$ 値の算出に関しては、化合物の5つの濃度より得られた阻害活性値より最少二乗法を用いた近似式で阻害曲線を求め、最大阻害活性の50%を示す化合物の濃度を求めた。

表 6

	IC50(uM)
化合物260	<3.00
化合物262	4.42
化合物264	4.36
化合物591	4.04
化合物592	9.51
化合物627	3.53
化合物628	3.59
化合物629	12.94
化合物630	3.50
化合物631	2.43
化合物632	28.66
化合物633	13.46
化合物634	16.87
化合物635	1.34
化合物636	5.30
化合物637	0.95
化合物638	4.22
化合物639	11.15
化合物640	15.59
化合物641	7.53
化合物642	13.30
化合物786	<3.00
化合物787	<3.00
化合物788	6.64
化合物789	9.28
化合物791	6.70
化合物793	8.46

	IC50(uM)
化合物794	9.57
化合物795	8.52
化合物800	10.05
化合物801	3.72
化合物802	5.96
化合物806	12.14
化合物807	9.07
化合物810	23.81
化合物811	37.22
化合物813	35.59
化合物814	18.34
化合物818	31.43
化合物822	18.01
化合物824	8.19
化合物827	24.37
化合物828	10.02
化合物829	<3.00
化合物830	10.73
化合物831	28.83
化合物832	6.40
化合物833	38.11
化合物834	52.10
化合物835	10.98
化合物836	10.18
化合物838	10.17
化合物839	23.15
化合物840	34.06

	IC50(uM)
化合物841	19.85
化合物845	<3.00
化合物846	<3.00
化合物858	<1.00
化合物859	1.60
化合物860	<1.00
化合物861	<1.00
化合物862	1.65
化合物863	6.90
化合物864	1.94
化合物865	4.34
化合物878	7.22
化合物880	1.30
化合物881	2.67
化合物882	4.45
化合物883	1.98
化合物884	35.90
化合物886	2.93
化合物887	15.06
化合物889	1.41
化合物890	1.33
化合物891	13.86
化合物893	5.11
化合物894	3.61
化合物895	5.52
化合物896	7.40
化合物899	<1.00

	IC50(uM)
化合物900	2.53
化合物901	<1.00
化合物902	<1.00
化合物903	<1.00
化合物904	1.69
化合物914	3.13
化合物935	9.68
化合物936	30.05
化合物985	<3.00
化合物987	16.31
化合物989	7.84
化合物990	7.14
化合物1007	1.00
化合物1008	2.30
化合物1009	1.41
化合物1020	2.25
化合物1027	1.58

#### 薬理試験例 4 : $^{32}\text{P}$ の腸管からの吸収に対する抑制作用

SD系ラット（6～7週齢、日本国 チャールスリバー社より入手）を3～4日間低リン食（リン0.1%含有、日本国 オリエンタル酵母社製）で飼育した後、約24時間絶食し、実験に供した。 $^{32}\text{P}$ は精製水あるいは液体飼料（日本国 日本クレア社）で希釈して0.7～3.5 MBq/mlとし、5 ml/kgの用量で強制経口投与（経口ゾンデによる胃内への投与）した。化合物あるいは媒体は $^{32}\text{P}$ 投与の30分前と $^{32}\text{P}$ 投与と同時の2回に分けて5 ml/kgの用量で強制経口投与した。 $^{32}\text{P}$ 投与の30分後、45分後あるいは60分後に尾動脈から採血し、液体シンチレーションカウンタにより血中 $^{32}\text{P}$ 放射活性を測定し、血中放射活性の増加抑制を腸管からのリンの吸収抑制の指標とした。

結果は下記式により抑制率で示した。

$$\frac{(\text{媒体投与群の血中放射活性} - \text{化合物投与群の血中放射活性})}{\text{媒体投与群の血中放射活性}} \times 100$$

また、血中放射活性の平均値の差の有意検定はt検定により行った。

その結果、表7に示すように、各化合物は腸管からのリン吸収を有意に抑制した。

表7 :  $^{32}\text{P}$  の腸管からの吸収に対する抑制作用

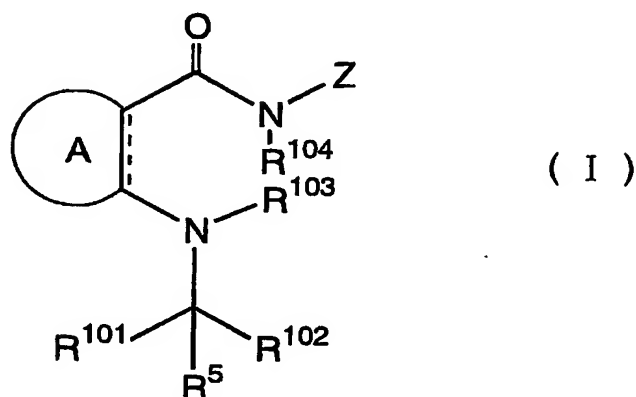
化合物	用量 (mg/kg)	血中放射活性抑制率 (%)
9 1	320	28.3
9 2	160	25.5
8 8	400	29.1
1 6 3	360	57.8
1 3 0	270	22.8
1 5 7	320	20.7
1 6 4	400	55.0
1 6 5	400	27.6
2 5 2	400	29.2
2 5 3	400	39.0
2 5 4	400	68.4
3 1 5	100	42.4
3 7 2	100	63.7
2 8 5	80	60.3

すべての化合物で  $p < 0.05$  で媒体投与群と比較し有意な差を認めた。

694

## 請求の範囲

1. 式(I)の化合物またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物。



(上記式中、

Aは、5～9員の不飽和の炭素環部分または5～9員の不飽和の複素環部分を表し、---は単結合または二重結合を表し、

Aが表す炭素環部分および複素環部分は

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c) C<sub>1-6</sub>アルキル基；
- (d) C<sub>1-6</sub>アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；
- (k) モノーまたはジ-アリールアミノ基；
- (l) モノーまたはジ-C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基；
- (m) C<sub>2-6</sub>アルケニル基；

(n)  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基；

(o)  $C_{2-6}$ アルケニルチオ基；

(p) モノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基；

(q) カルボキシ基；または

(r)  $C_{1-6}$ アルキル-またはアリール-オキシカルボニル基；

により置換されていてもよく、

(c)  $C_{1-6}$ アルキル基、(d)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、(h) アルキルチオ基、(m)  $C_{2-6}$ アルケニル基、(n)  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基、および(o)  $C_{2-6}$ アルケニルチオ基は、更に(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい）、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、(14) アリールアミノ基（このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい）、(15)  $C_{1-6}$ アルコキシ- $(CH_2CH_2O)_m$ 基（ここで、 $m$ は1～6の整数を表す）、(16) カルボキシ基、(17) 酸素原子（=O）、または(18)  $C_{3-7}$ シクロアルキル基により置換されていてもよく、

(k) モノーまたはジ-アリールアミノ基においてアリール部分は更に、(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい）、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、(14) アリールアミノ基（このアミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置

換されていてもよい)、(15)  $C_{1-6}$ アルコキシ $-(CH_2CH_2O)_m$ 基(ここで $m$ は1~6の整数を表す)、(16)カルボキシル基、(17)酸素原子( $=O$ )、または(18)  $C_{3-7}$ シクロアルキル基により置換されていてもよく、モノアリアルアミノ基の場合アミノ基は更に、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)によって置換されていてもよく、

(1) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$ アルキル基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$ アルキル( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリアル基(アリアル基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基(複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成してもよい)； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の1または2つの $C_{1-6}$ アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)；アリアルアミノ基(アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい)；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい)；アリアルオキシ基；アリアルチオ基；酸素原子( $=O$ )；水酸基；カルボキシル基； $C_{1-6}$ アルコキシまたはアリアルオキシカルボニル基； $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基；アリアル基(このアリアル基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい)；または複素環式基により更に置換されていてもよく、

(p) モノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基において、モノアルケニルアミノ基の場合アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)によって置換されていてもよく、ジ- $C_{2-6}$ アルケニル基は一緒になって不飽和環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルケニル基もしくは不飽和環状アミノ部分は、ハロゲン原子; $C_{1-6}$ アルキル( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基(アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基(複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成してもよい); $C_{1-6}$ アルコキシ基; $C_{1-6}$ アルキルチオ;モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の1または2つの $C_{1-6}$ アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい);アリールアミノ基(アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい);モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい);アリールオキシ基;アリールチオ基;酸素原子(=O);水酸基;カルボキシル基; $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基; $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基;アリール基(このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい);または複素環式基により更に置換されていてもよく、

Aが表す炭素環部分および複素環部分が2つの(c) $C_{1-6}$ アルキル基または(m) $C_{2-6}$ アルケニル基により置換されている場合には、これらのアルキル基または



アルケニル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

$R^5$ は、 $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、または複素環式基を表し、 $R^5$ が表す $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$ シクロアルキル基、または複素環式基は、同一または異なっているいてもよく、下記基：

(I) ハロゲン原子；

(II) (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、(8') 複素環式基により置換されたアミノ基（この複素環式基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）、(9)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールスルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$ アルキルまたはアリールウレイド基、(19)  $C_{1-6}$ アルコキシまたはアリールオキシカルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$ アルキルアミノまたはアリールアミノカルボニルオキシ基、(21) カルボキシ基、(22) ニトロ基、(23) 複素環式基、(23')  $Het-S(=O)_j-$  ( $Het$ は複素環式基を表し、 $j$ は0、1、または2を表し、 $Het$ はモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい）、(24) シアノ基、および(25) ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい $C_{1-6}$ アルキル基

(ここで、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、および(7)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基のアルキル部分は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシル基、 $-S(=O)_2(-OH)$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基 (この複素環式基はモノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$  アルキル ( $C_{1-6}$  アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基 (アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基 (複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい) により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$  アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$  シクロアルキル基を形成していてもよい)； $C_{1-6}$  アルコキシ基； $C_{1-6}$  アルキルチオ基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい)；アリールアミノ基 (アミノ基は更に $C_{1-6}$  アルキル基

により置換されていてもよい) ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールオキシ基; アリールチオ基; 酸素原子(=O); 水酸基; カルボキシル基;  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基;  $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基; アリール基 (このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基により更に置換されていてもよく、環状アミノ部分の一つの炭素原子が同一または異なってもよい二つの $C_{1-6}$ アルコキシ基により置換されているとき、この二つのアルコキシ基は一緒になって基-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O- (ここでpは2~4の整数を表す) を形成してもよく、環状アミノ基は単環性または二環性の芳香族炭素環または単環性または二環性の芳香族複素環と縮合して二環性または三環性複素環式基を表すことができる。) ;

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基;

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基;

(V)  $C_{3-7}$ シクロアルキル基;

(VI) アリール基;

(VII) アリールオキシ基;

(VIII)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基;

(VIX)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基;

(X) 水酸基;

(XI) ニトロ基;

(XII) シアノ基;

(XIII) アミノ基;

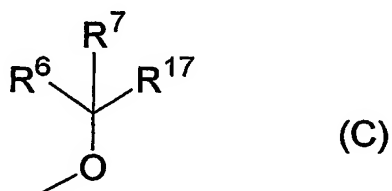
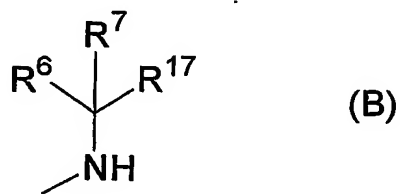
(XIV) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい) ;

(XV) アリールアミノ基;

- (XVI)  $C_{1-6}$  アルキルーまたはアリールースルホニルアミノ基；  
 (XVII)  $C_{1-6}$  アルキルーまたはアリールウレイド基；  
 (XVIII)  $C_{1-6}$  アルコキシーまたはアリールオキシカルボニルアミノ基；  
 (XIX)  $C_{1-6}$  アルキルアミノーまたはアリールアミノカルボニルオキシ基；  
 (XX)  $C_{1-6}$  アルコキシーまたはアリールオキシカルボニル基；  
 (XXI) アシル基；  
 (XXII) カルボキシル基；  
 (XXIII) カルバモイル基；  
 (XXIV) モノーまたはジアルキルカルバモイル基；  
 (XXV) 複素環式基；  
 (XXVI) アルキルーまたはアリールースルホニル基；  
 (XXVII)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基；または  
 (XXVIII)  $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基

により置換されていてもよく、

Zは基(A)、基(B)、または基(C)



を表し、

ここで、 $R^6$ および $R^7$ は、同一または異なっているいてもよく、水素原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{2-6}$ アルケニル基、 $C_{2-6}$ アルキニル基、アリール基、アリー

ル $C_{1-6}$ アルキル基、アリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または複素環式基を表し、 $C_{1-6}$ アルキル基、アリール基、アリール $C_{1-6}$ アルキル基、アリール $C_{2-6}$ アルケニル基、および複素環式基は、同一または異なっているとしてもよく、下記基：

(I) ハロゲン原子；

(II) (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5) 水酸基により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成しているとしてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、(9)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールースルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールーウレイド基、(19)  $C_{1-6}$ アルコキシーまたはアリールオキシーカルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$ アルキルアミノーまたはアリールアミノーカルボニルオキシ基、(21) カルボキシル基、(22) ニトロ基、(23) 複素環式基、(23') H e t - S - (H e t は複素環式基を表す)、(24) シアノ基、(25) ハロゲン原子、および(26)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールーオキシカルボニル基からなる群から選択される置換基を有しているとしてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；

(III) (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5) 水酸基により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成しているとしてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、(9)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールースルホニルアミノ基、

(18)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールーウレイド基、(19)  $C_{1-6}$ アルコキシーまたはアリールオキシーカルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$ アルキルアミノーまたはアリールアミノーカルボニルオキシ基、(21)カルボキシル基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')  $Het-S-$  ( $Het$ は複素環式基を表す)、(24)シアノ基、(25)ハロゲン原子、および(26)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールーオキシカルボニル基からなる群から選択される置換基を有していてもよい  $C_{1-6}$ アルコキシ基；

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$ アルキルチオ基；

(V)  $C_{3-7}$ シクロアルキル基；

(VI) アリール基；

(VII) アリールオキシ基；

(VIII)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルアミノ基；

(VIX)  $C_{1-6}$ アルキルカルボニルオキシ基；

(X) 水酸基；

(XI) ニトロ基；

(XII) シアノ基；

(XIII) アミノ基；

(XIV) モノーまたはジ-  $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ-  $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい) ；

(XV) アリールアミノ基；

(XVI)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールースルホニルアミノ基；

(XVII)  $C_{1-6}$ アルキルーまたはアリールーウレイド基；

(XVIII)  $C_{1-6}$ アルコキシーまたはアリールオキシーカルボニルアミノ基；

(XIX)  $C_{1-6}$ アルキルアミノーまたはアリールアミノーカルボニルオキシ基；

(XX)  $C_{1-6}$ アルコキシーまたはアリールオキシーカルボニル基；

(XXI) アシル基；

(XXII) カルボキシル基；

(XXIII) カルバモイル基；

(XXIV) モノーまたはジールキルカルバモイル基；

(XXV) 複素環式基；

(XXVI) アルキルーまたはアリールースルホニル基；または

(XXVII)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基；または

(XXVIII)  $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基

により置換されていてもよく、

$R^{17}$  は水素原子を表し、

$R^{101}$  と  $R^{102}$  が一緒になって  $=O$  を表し、かつ  $R^{103}$  および  $R^{104}$  が水素原子を表すか、あるいは

$R^{101}$  と  $R^{104}$  が一緒になって結合を表し、かつ  $R^{102}$  と  $R^{103}$  とが一緒になって結合を表す。)

2. A が、5～9 員の不飽和の炭素環部分または 5～9 員の不飽和の複素環部分を表し、--- が二重結合を表し、

A が表す炭素環部分および複素環部分が

(a) ハロゲン原子；

(b) 水酸基；

(c)  $C_{1-6}$  アルキル基；

(d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基；

(e) アリール基；

(f) アリールオキシ基；

(g) アリールチオ基；

(h) アルキルチオ基；

(i) ニトロ基；または

(j) アミノ基

により置換されていてもよく、

(c)  $C_{1-6}$  アルキル基、(d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、および (h) アルキルチオ基は、更に (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ

基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルフォニル基、(7) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよい）、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルフォニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または(14) アリールアミノ基（このアミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよく、

この炭素環部分および複素環部分が 2 つの(c)  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されている場合には、これらのアルキル基は一緒になって  $C_{3-6}$  アルキレン鎖を形成してもよく、

$R^5$  が、 $C_{1-6}$  アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$  シクロアルキル基、または複素環式基を表し、 $R^5$  が表す  $C_{1-6}$  アルキル基、アリール基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、アリールオキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、アリールアミノ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、アリールチオ基、 $C_{3-7}$  シクロアルキル基、または複素環式基は、同一または異なってもよく、下記基：

(I) ハロゲン原子；

(II) (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、(7)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基、(8') 複素環式基により置換されたアミノ基（この複素環式基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよい）、(9)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$  アルキルーまたはアリールスルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$  アルキルーまたはアリールウレイド基、(19)  $C_{1-6}$  アルコキシーまたはアリールオキシカルボニルアミノ基、(20) C



$1-6$  アルキルアミノーまたはアリールアミノーカルボニルオキシ基、(21)カルボキシ基、(22)ニトロ基、(23)複素環式基、(23')  $\text{Het-S(=O)}_j-$  ( $\text{Het}$  は複素環式基を表し、 $j$  は 0、1、または 2 を表し、 $\text{Het}$  はモノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい)、(24)シアノ基、および(25)ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基

(ここで、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、および(7)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基のアルキル部分は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシ基、 $-\text{S(=O)}_2(-\text{OH})$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシーまたはアリールオキシーカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基

(この複素環式基はモノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい) により置換されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1~3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子；水酸基により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル； $C_{1-6}$  アルコキシ基； $C_{1-6}$  アルキルチオ基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基は、水酸基により置

換されていてもよい) ; アリールアミノ基 (アミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよい) ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルカルバモイルメチル基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールオキシ基 ; アリールチオ基 ; 酸素原子 (=O) ; 水酸基 ; カルボキシ基 ;  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基 ;  $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基 ; アリール基 (このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基により更に置換されていてもよい) ;

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ;

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルチオ基 ;

(V)  $C_{3-7}$  シクロアルキル基 ;

(VI) アリール基 ;

(VII) アリールオキシ基 ;

(VIII)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基 ;

(VIX)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基 ;

(X) 水酸基 ;

(XI) ニトロ基 ;

(XII) シアノ基 ;

(XIII) アミノ基 ;

(XIV) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) ;

(XV) アリールアミノ基 ;

(XVI)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基 ;

(XVII)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-ウレイド基 ;

(XVIII)  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基 ;

(XIX)  $C_{1-6}$  アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基 ;

(XX)  $C_{1-6}$ アルコキシまたはアリーロキシカルボニル基；

(XXI) アシル基；

(XXII) カルボキシル基；

(XXIII) カルバモイル基；

(XXIV) モノまたはジアルキルカルバモイル基；

(XXV) 複素環式基；

(XXVI) アルキルまたはアリールスルホニル基；

(XXVII)  $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基；または

(XXVIII)  $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基

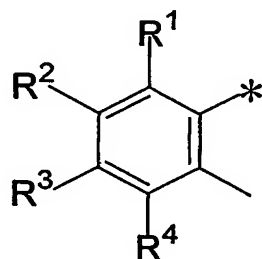
により置換されていてもよく、

Zが基Aまたは基B（ここで、 $R^6$ 、 $R^7$ 、および $R^{17}$ は、請求項1で定義された内容と同義である）を表し、

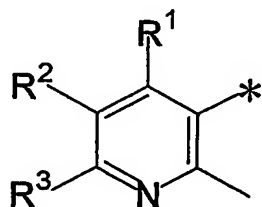
$R^{101}$ と $R^{102}$ が一緒になって=Oを表し、かつ $R^{103}$ および $R^{104}$ が水素原子を表すか、あるいは

$R^{101}$ と $R^{104}$ が一緒になって結合を表し、かつ $R^{102}$ と $R^{103}$ とが一緒になって結合を表す、請求項1に記載の化合物。

3. Aが式(IIa)または式(IIa')を表す、請求項1または2に記載の化合物。



(IIa)



(IIa')

(上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、同一または異なっているいてもよく、

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c)  $C_{1-6}$  アルキル基；
- (d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；
- (k) モノーまたはジ-アリールアミノ基；
- (l) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基；
- (m)  $C_{2-6}$  アルケニル基；
- (n)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基；
- (o)  $C_{2-6}$  アルケニルチオ基；
- (p) モノーまたはジ- $C_{2-6}$  アルケニルアミノ基；
- (q) カルボキシル基；
- (r)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-オキシカルボニル基；または
- (s) 水素原子

を表し、

(c)  $C_{1-6}$  アルキル基、(d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、(h) アルキルチオ基、(m)  $C_{2-6}$  アルケニル基、(n)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基、および(o)  $C_{2-6}$  アルケニルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、

(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または(14) アリールアミノ基（このアミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい）(15)  $C_{1-6}$  アルコキシ（ $CH_2CH_2O$ ） $m$  基（ここで、 $m$  は 1 ～ 6 の整数を表す）、(16) カルボキシル基、(17) 酸素原子（=O）、または(18)  $C_{3-7}$  シクロアルキル基により置換されていてもよく、

(k) モノーまたはジーアリールアミノ基においてアリール部分は更に、(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノーまたはジー  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ～ 3 個の異種原子を含んでもよい）、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、(14) アリールアミノ基（このアミノ基はさらに  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい）、(15)  $C_{1-6}$  アルコキシ（ $CH_2CH_2O$ ） $m$  基（ここで  $m$  は 1 ～ 6 の整数を表す）、(16) カルボキシル基、(17) 酸素原子（=O）、または(18)  $C_{3-7}$  シクロアルキル基により置換されていてもよく、モノアリールアミノ基の場合アミノ基は更に、 $C_{1-6}$  アルキル基（ $C_{1-6}$  アルキル基は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい）によって置換されていてもよく、

(1) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$  アルキル基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ～ 3 個の異種原子を含んでもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$  アルキル（ $C_{1-6}$  アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基（アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）、複素環式基（複素環式

基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成してもよい);  $C_{1-6}$ アルコキシ基;  $C_{1-6}$ アルキルチオ; モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の1または2つの $C_{1-6}$ アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい); アリールアミノ基(アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい); モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい); アリールオキシ基; アリールチオ基; 酸素原子(=O); 水酸基; カルボキシル基;  $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基;  $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基; アリール基(このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい); または複素環式基により更に置換されていてもよく、

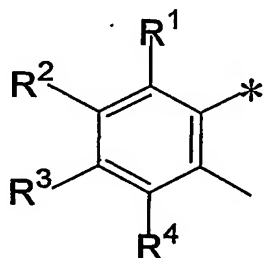
(p) モノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基において、モノアルケニルアミノ基の場合アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)によって置換されていてもよく、ジ- $C_{2-6}$ アルケニル基は一緒になって不飽和環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルケニル基もしくは不飽和環状アミノ部分は、ハロゲン原子;  $C_{1-6}$ アルキル( $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基(アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基(複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基およ

び環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成してもよい)； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、このアミノ基上の1または2つの $C_{1-6}$ アルキル基および環状アミノ部分は水酸基もしくはハロゲン原子によって置換されていてもよい)；アリールアミノ基(アミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい)；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい)；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子(=O)；水酸基；カルボキシル基； $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基； $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基；アリール基(このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい)；または複素環式基により更に置換されていてもよく、

Aが表す炭素環部分および複素環部分が2つの(c)  $C_{1-6}$ アルキル基または(m)  $C_{2-6}$ アルケニル基により置換されている場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

\*は $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$ との結合を表す。)

4. Aが式(IIa)を表す、請求項1または2に記載の化合物。



(IIa)

(上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、同一または異なってもよく、

- (a) ハロゲン原子；
- (b) 水酸基；
- (c)  $C_{1-6}$  アルキル基；
- (d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基；
- (e) アリール基；
- (f) アリールオキシ基；
- (g) アリールチオ基；
- (h) アルキルチオ基；
- (i) ニトロ基；
- (j) アミノ基；または
- (k) 水素原子

を表し、

(c)  $C_{1-6}$  アルキル基、(d)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(e) アリール基、(f) アリールオキシ基、(g) アリールチオ基、および(h) アルキルチオ基は、更に(1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよく、

\*は $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$ との結合を表す。）

5.  $R^1$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が、同一または異なってもよく、  
水素原子；

ハロゲン原子；

$C_{1-6}$ アルキル基（このアルキル基は、 $C_{1-6}$ アルコキシ基またはハロゲン原



子により置換されていてもよい) ;

アリール基 (このアリール基は、 $C_{1-6}$  アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ;

$C_{1-6}$  アルコキシ基 (このアルコキシ基は、 $C_{1-6}$  アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい) ; または

アリールオキシ基 (このアリールオキシ基は、 $C_{1-6}$  アルコキシ基またはハロゲン原子により置換されていてもよい)

を表し、

$R^2$  が

水素原子 ;

ハロゲン原子 ;

水酸基 ;

$C_{1-6}$  アルキル基 (このアルキル基は、(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) 、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子、または(14) アリールアミノ基 (このアミノ基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、または  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい) ; または

$C_{1-6}$  アルコキシ基 (このアルコキシ基は、(1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノまたはジ  $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) 、(8) アリールオキシ基、(9) アリールチオ基、(10) アリールスルホニル基、(11) アリール基、(12) 複素環式基、(13) ハロゲン原子により置換されていてもよい)

を表す、請求項 3 または 4 に記載の化合物。

6.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が、同一または異なっているとしてもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{2-6}$ アルケニル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジアーリールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでもよい）；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基（ジ $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでもよい）を表し、 $R^2$ および $R^3$ が置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基または置換基を有してもよい $C_{2-6}$ アルケニル基である場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基は $R^2$ および $R^3$ が結合している炭素原子と一緒に不飽和の 5～7 員炭素環を形成してもよい、請求項 3 または 4 に記載の化合物。

7.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が、同一または異なっているとしてもよく、水素原子；ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；または置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表す、請求項 3 または 4 に記載の化合物。

8.  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が水素原子を表す、請求項 3 または 4 に記載の化合物。

9.  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジアーリールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジアル

キルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)；置換基を有してもよいモノーまたはジ-C<sub>2-6</sub>アルケニルアミノ基(ジC<sub>2-6</sub>アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)を表し、他方が水素原子を表す、請求項3または4に記載の化合物。

10. R<sup>1</sup>およびR<sup>4</sup>が水素原子を表し、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基；置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表す、請求項3または4に記載の化合物。

11. R<sup>1</sup>およびR<sup>4</sup>が水素原子を表し、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基；置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基を表す、請求項3または4に記載の化合物。

12. R<sup>1</sup>およびR<sup>4</sup>が水素原子を表し、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が、これらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成している、請求項3または4に記載の化合物。

13. R<sup>1</sup>およびR<sup>4</sup>が水素原子を表し、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>が同一または異なってもよく、置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルコキシ基を表す、請求項3または4に記載の化合物。

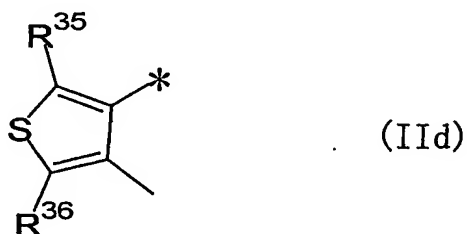
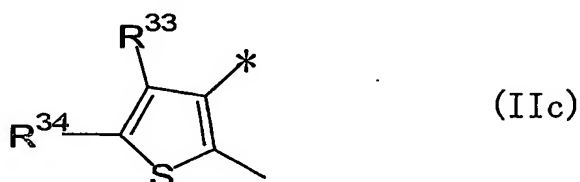
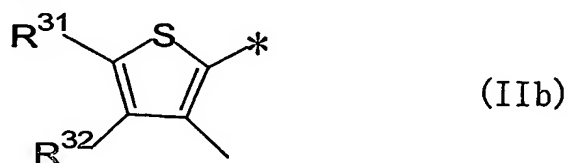
14. R<sup>1</sup>およびR<sup>4</sup>が水素原子を表し、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>のいずれか一方が置換基を有してもよいモノまたはジ-C<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基(ジC<sub>1-6</sub>アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、更に環状アミノ基は1～3の異種原子を含んでもよい)を表し、他方が水素原子を表す、請求項3または4に記載の

化合物。

15.  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表し、 $R^2$  および  $R^3$  のいずれか一方が置換基を有してもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表す、請求項3または4に記載の化合物。

16.  $R^1$  および  $R^4$  が水素原子を表す、請求項6または7に記載の化合物。

17. A が式 (IIb)、式 (IIc)、または式 (IId) を表す、請求項1または2に記載の化合物。



(上記式中、

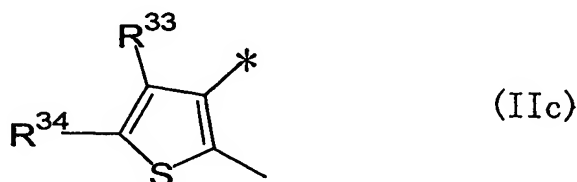
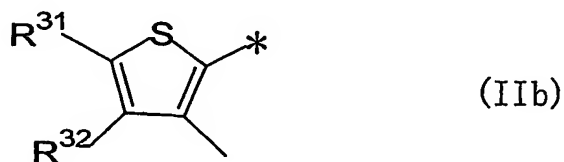
$R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$ 、 $R^{34}$ 、 $R^{35}$ 、および  $R^{36}$  は、同一または異なっているもよく、水素原子；ハロゲン原子；または  $C_{1-6}$  アルキル基（このアルキル基は (1) 水酸基、(2) チオール基、(3) アミノ基、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基、(7) モノーまたはジ- $C_{1-6}$

アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）、(8)アリールオキシ基、(9)アリールチオ基、(10)アリールスルホニル基、(11)アリール基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、(14)アリールアミノ基（このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリール基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい）により置換されていてもよい）；または $C_{2-6}$ アルケニル基を表し、

$R^{31}$ と $R^{32}$ がアルキル基またはアルケニル基を表す場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、 $R^{33}$ と $R^{34}$ がアルキル基またはアルケニル基を表す場合には、これらのアルキル基またはアルケニル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

\*は $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$ との結合を表す。）

18. Aが式(IIb)または式(IIc)を表す、請求項1または2に記載の化合物。



(上記式中、

$R^{31}$ 、 $R^{32}$ 、 $R^{33}$ 、および $R^{34}$ は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子；または $C_{1-6}$ アルキル基（このアルキル基は(1)水酸基、(2)

チオール基、(3)アミノ基、(4)  $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(7)モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、(8)アリアルオキシ基、(9)アリアルチオ基、(10)アリアルスルホニル基、(11)アリアル基、(12)複素環式基、(13)ハロゲン原子、または(14)アリアルアミノ基 (このアミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよく、アリアル基はハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、または $C_{1-6}$ アルキルアミノ基により置換されていてもよい) により置換されていてもよい) を表し、

$R^{31}$ と $R^{32}$ がアルキル基を表す場合には、これらのアルキル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

$R^{33}$ と $R^{34}$ がアルキル基を表す場合には、これらのアルキル基はそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、

\*は $-C(=O)-N(-Z)(-R^{104})$ との結合を表す。) )

19. Aが式(IIb)を表し、

(i)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基 ( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、

(iii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基 ( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい) を表すか、あるいは

(iv)  $R^{31}$ と $R^{32}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成している、

請求項17または18に記載の化合物。

20. Aが式(IIb)を表し、 $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、または $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、あるいは $R^{31}$ と $R^{32}$ がそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成している、請求項17または18に記載の化合物。

21. Aが式(IIc)を表し、

(i)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{33}$ と $R^{34}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成している、  
請求項17または18に記載の化合物。

22. Aが式(IIc)を表し、 $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、または $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、あるいは $R^{33}$ と $R^{34}$ がそれらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成している、請求項17または18に記載の化合物。

23. Aが式(II d)を表し、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表す、請求項17に記載の化合物。

24.  $R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の9～11員二環性複素環式基である、請求項1または2に記載の化合物。

25. アリール基がフェニル基またはナフチル基である、請求項24に記載の化合物。

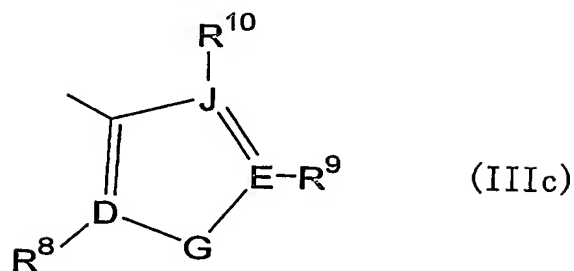
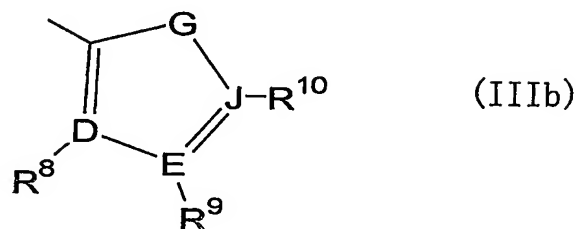
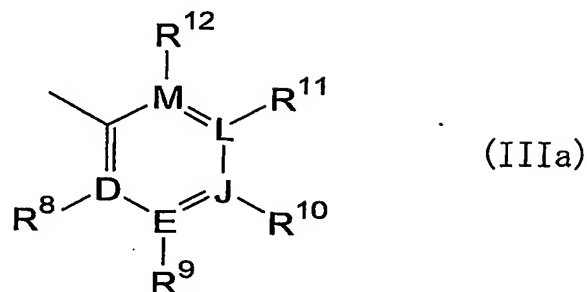
26. 複素環式基が、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、ピリミジル基、およびキノキサリニル基から選択される、請求項24に記載の化合物。

27.  $R^5$ が、 $C_{5-7}$ シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、ピリミジル基、およびキノキサリニル基から選択される環状基（この環状基は、ハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；または水酸基により置換されていてもよい）を表す、請求項1または2に記載の化合物。

28.  $R^5$ が、 $C_{5-7}$ シクロアルキル基、フェニル基、ピリジル基、フリル基、チエニル基、イソキサゾール基、ピリミジル基、およびキノキサリニル基から選択される環状基（この環状基は、 $C_{1-6}$ アルキルにより置換されていてもよく、このアルキル基は、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルチオ基、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、または置換されていてもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）により更に置換されていてもよい）を表す、請求項1または2に記載の化合物。



29.  $R^5$ が、式(IIIa)、式(IIIb)、または式(IIIc)の基を表す、請求項1または2に記載の化合物。



(上記式中、

D、E、J、L、およびMは、同一または異なってもよく、炭素原子または窒素原子を表し、

Gは酸素原子または硫黄原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ は、同一または異なってもよく、

(I) ハロゲン原子；

(II) (1)水酸基、(2)チオール基、(3)アミノ基、(4) $C_{1-6}$ アルコキシ基、(5) $C_{1-6}$ アルキルチオ基、(6) $C_{1-6}$ アルキルスルフィニル基、(7) $C_{1-6}$ アルキルスルホニル基、(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基、(8')複素

環式基により置換されたアミノ基（この複素環式基は更に  $C_{1-6}$  アルキル基により置換されていてもよい）、(9)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基、(10)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルチオ基、(11)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基、(12) アリールオキシ基、(13) アリールチオ基、(14) アリールスルフィニル基、(15) アリールスルホニル基、(16) アリールアミノ基、(17)  $C_{1-6}$  アルキルまたはアリールスルホニルアミノ基、(18)  $C_{1-6}$  アルキルまたはアリールウレイド基、(19)  $C_{1-6}$  アルコキシまたはアリールオキシカルボニルアミノ基、(20)  $C_{1-6}$  アルキルアミノまたはアリールアミノカルボニルオキシ基、(21) カルボキシ基、(22) ニトロ基、(23) 複素環式基、(23')  $H e t - S (=O)_j - (H e t$  は複素環式基を表し、 $j$  は 0、1、または 2 を表し、 $H e t$  はモノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）により置換されていてもよいアルキル基により置換されていてもよい）、(24) シアノ基、および(25) ハロゲン原子からなる群から選択される置換基を有していてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基

（ここで、(4)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、(5)  $C_{1-6}$  アルキルチオ基、(6)  $C_{1-6}$  アルキルスルフィニル基、および(7)  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル基のアルキル部分は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ基、 $C_{1-6}$  アルキルチオ基、モノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよい）、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシ基、 $-S (=O)_2 (-OH)$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシまたはアリールオキシカルボニル基、 $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基、アリール基、または複素環式基（この複素環式基はモノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1～3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい）により置換

されていてもよく、また

(8) モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基において、ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、ハロゲン原子； $C_{1-6}$ アルキル（ $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基（アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）、複素環式基（複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シクロアルキル基を形成していてもよい）； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールオキシ基；アリールチオ基；酸素原子（=O）；水酸基；カルボキシル基； $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基； $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基；アリール基（このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい）；または複素環式基により更に置換されていてもよく、環状アミノ部分の一つの炭素原子が同一または異なってもよい二つの $C_{1-6}$ アルコキシ基により置換されているとき、この二つのアルコキシ基は一緒になって基-O- $(CH_2)_p$ -O-（ここでpは2~4の整数を表す）を形成してもよく、環状アミノ基は単環性または二環性の芳香族炭素環または単環性または二環性の芳香族複素環と縮合して二環性または三環性複素環式基を表

すことができる。) ;

(III) ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルコキシ基 ;

(IV) ハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキルチオ基 ;

(V)  $C_{3-7}$  シクロアルキル基 ;

(VI) アリール基 ;

(VII) アリールオキシ基 ;

(VIII)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルアミノ基 ;

(VIX)  $C_{1-6}$  アルキルカルボニルオキシ基 ;

(X) 水酸基 ;

(XI) ニトロ基 ;

(XII) シアノ基 ;

(XIII) アミノ基 ;

(XIV) モノーまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよい) ;

(XV) アリールアミノ基 ;

(XVI)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-スルホニルアミノ基 ;

(XVII)  $C_{1-6}$  アルキル-またはアリール-ウレイド基 ;

(XVIII)  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニルアミノ基 ;

(XIX)  $C_{1-6}$  アルキルアミノ-またはアリールアミノ-カルボニルオキシ基 ;

(XX)  $C_{1-6}$  アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基 ;

(XXI) アシル基 ;

(XXII) カルボキシル基 ;

(XXIII) カルバモイル基 ;

(XXIV) モノーまたはジ-アルキルカルバモイル基 ;

(XXV) 複素環式基 ;

(XXVI) アルキル-またはアリール-スルホニル基 ;

(XXVII)  $C_{2-6}$  アルケニルオキシ基 ;

(XXVIII)  $C_{2-6}$  アルキニルオキシ基 ; または

## (XXIX) 水素原子

を表し、

D、E、J、L、またはMが窒素原子を表す場合、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ はそれぞれ存在しないか、あるいは窒素原子と一緒になってN-オキシド ( $N \rightarrow O$ ) を形成していてもよい。) )

30.  $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ が、同一または異なっているもよく、

水素原子；

ハロゲン原子；

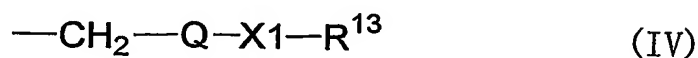
ヒドロキシメチル基；

ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；または

ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基

を表す、請求項29に記載の化合物。

31.  $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ が表すことがある置換された $C_{1-6}$ アルキル基が、式 (IV) の基



(上記式中、

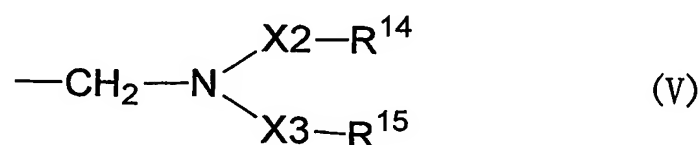
Qは、酸素原子、硫黄原子、スルフィニル基、またはスルホニル基を表し、

X1は結合または炭素数1～5の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

$R^{13}$ は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル基、 $C_{1-6}$ アルコキシ基、 $C_{1-6}$ アルキルチオ基、モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)、アリールオキシ基、アリールチオ基、水酸基、カルボキシ基、 $-\text{S}(=\text{O})_2(-\text{OH})$ 、 $C_{1-6}$ アルコキシ-またはアリールオキシ-カルボニル基、 $C_{1-6}$ アルキルカルボニル基、アリール

基、または複素環式基（この複素環式基はモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）により置換されていてもよいアルキル基により更に置換されていてもよい）；

または式（V）の基



（上記式中、

X2は結合または炭素数1～5の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

X3は結合または炭素数1～5の直鎖または分岐鎖のアルキレン鎖を表し、

$R^{14}$ および $R^{15}$ は、同一または異なってもよく、水素原子；ハロゲン原子； $C_{1-6}$ アルキル（ $C_{1-6}$ アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基（アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）、複素環式基（複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$ アルキル、もしくは $C_{1-6}$ アルキルオキシ基によって置換されていてもよい）により置換されていてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分が2つの $C_{1-6}$ アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって $C_{3-7}$ シグロアルキル基を形成していてもよい）； $C_{1-6}$ アルコキシ基； $C_{1-6}$ アルキルチオ基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（アミノ基は更に $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルカルバモイルメチル基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の1または2つのアルキル基

および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; アリールオキシ基 ; アリールチオ基 ; 酸素原子 (=O) ; 水酸基 ; カルボキシ基 ;  $C_{1-6}$  アルコキシまたはアリールオキシカルボニル基 ;  $C_{1-6}$  アルキルカルボニル基 ; アリール基 (このアリール基はハロゲン原子または水酸基により置換されていてもよい) ; または複素環式基を表し、但し、 $X_2$  が結合を表す場合には  $R^{14}$  は水素原子を表し、 $X_3$  が結合を表す場合には  $R^{15}$  は水素原子を表し、あるいは

$R^{14}$  および  $R^{15}$  はそれらが結合している窒素原子と一緒になって複素環式基を形成してもよく、この複素環式基は  $R^{14}$  および  $R^{15}$  が結合している窒素原子以外に更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、この複素環式基は更に水酸基 ;  $C_{1-6}$  アルキル ( $C_{1-6}$  アルキルは水酸基、ハロゲン原子、アリール基 (アリール基はハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい)、複素環式基 (複素環式基は、ハロゲン原子、 $C_{1-6}$  アルキル、もしくは  $C_{1-6}$  アルキルオキシ基によって置換されていてもよい) により置換されていてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分が 2 つの  $C_{1-6}$  アルキル基によって置換される場合、それぞれは一緒になって  $C_{3-7}$  シクロアルキル基を形成していてもよい) ; モノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; 飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 ; モノまたはジ- $C_{1-6}$  アルキルカルバモイルメチル基 (ジ- $C_{1-6}$  アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に 1 ~ 3 個の異種原子を含んでいてもよく、アミノ基上の 1 または 2 つのアルキル基および環状アミノ部分は、水酸基により置換されていてもよい) ; フェニル基 ; または酸素原子 (=O) により置換されていてもよく、環状アミノ部分の一つの炭素原子が同一または異なってもよい二つの  $C_{1-6}$  アルコキシ基により置換されているとき、この二つのアルコキシ基は一緒になって基-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O- (ここで p は 2 ~ 4 の整数を表す) を形成してもよく、環状アミノ基は単環性ま

たは二環性の芳香族炭素環または単環性または二環性の芳香族複素環と縮合して二環性または三環性複素環式基を表すことができる。)を表す、請求項27に記載の化合物。

32. D、E、J、L、およびMが炭素原子を表す、請求項29～31のいずれか一項に記載の化合物。

33. D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す、請求項29～31のいずれか一項に記載の化合物。

34.  $R^5$ が式(III a)を表し、D、E、J、L、およびMが炭素原子を表す、請求項29～31のいずれか一項に記載の化合物。

35.  $R^5$ が式(III a)を表し、D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表す、請求項29～31のいずれか一項に記載の化合物。

36.  $R^5$ が式(III b)を表し、D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表す、請求項29～31のいずれか一項に記載の化合物。

37.  $R^5$ が式(III c)を表し、D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表す、請求項29～31のいずれか一項に記載の化合物。

38.  $R^5$ が式(III a)を表し、

D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置



換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

39.  $R^5$ が式(III a)を表し、

D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

40.  $R^5$ が式(III b)を表し、

D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、

$R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

41.  $R^5$ が式(III c)を表し、

D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、

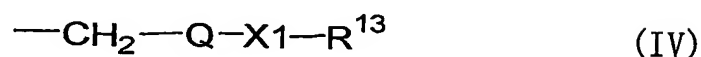
$R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

42.  $R^5$ が式(III a)を表し、

D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、

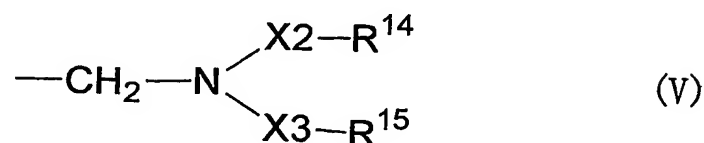
731

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、およびR<sup>12</sup>が水素原子を表し、  
R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X1、およびR<sup>13</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

または式 (V) の基



(上記式中、X2、X3、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

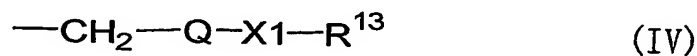
を表し、残りの基が水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

43. R<sup>5</sup>が式 (III a) を表し、

D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、

R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、およびR<sup>12</sup>が水素原子を表し、

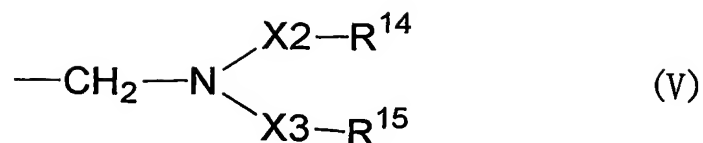
R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X1、およびR<sup>13</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

または式 (V) の基

732

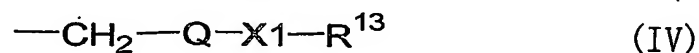


(上記式中、X<sub>2</sub>、X<sub>3</sub>、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

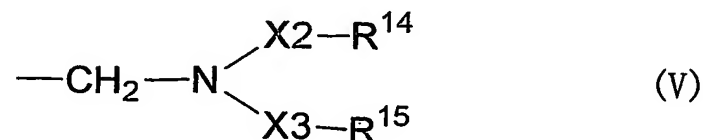
44. R<sup>5</sup>が式(IIIb)を表し、

D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、およびR<sup>10</sup>のうち一つが式(IV)の基



(上記式中、Q、X<sub>1</sub>、およびR<sup>13</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

または式(V)の基



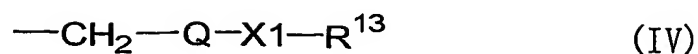
(上記式中、X<sub>2</sub>、X<sub>3</sub>、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

45. R<sup>5</sup>が式(IIIc)を表し、

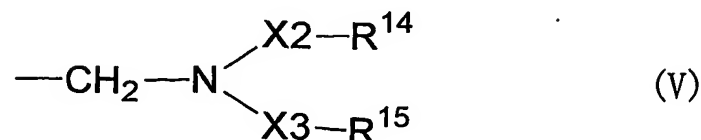
D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、およびR<sup>10</sup>のうち一つが式(IV)の基

733



(上記式中、Q、X1、およびR<sup>13</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

または式(V)の基



(上記式中、X2、X3、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表す、請求項29に記載の化合物。

46. R<sup>6</sup>が、水素原子；置換基を有してもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基；または置換基を有していてもよいアリール基を表し、R<sup>7</sup>が、置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリールC<sub>1-6</sub>アルキル基、置換を有していてもよいアリールC<sub>2-6</sub>アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表す、請求項1または2に記載の化合物。

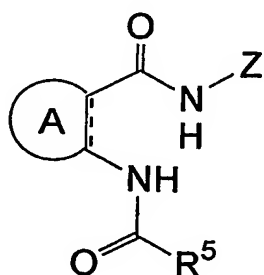
47. R<sup>6</sup>が、水素原子；ハロゲン原子またはC<sub>1-6</sub>アルコキシ基により置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキル基；またはハロゲン原子、C<sub>1-6</sub>アルキル基、またはC<sub>1-6</sub>アルコキシ基により置換されていてもよいアリール基を表す、請求項46に記載の化合物。

48. R<sup>6</sup>が、水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を表す、請求項46に記載の化合物。

49. R<sup>7</sup>が、フェニル基、ナフチル基、フリル基、ピロリル基、およびチ

エニル基から選択される環状基（この環状基は、ハロゲン原子；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基； $C_{1-6}$ アルコキシ基（このアルコキシ基は、ハロゲン原子；アリールオキシ基（このアリールオキシ基はハロゲン原子及び $C_{1-6}$ アルキル基により置換されてもよい）； $C_{1-6}$ アルコキシ基（このアルコキシ基は、モノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミン（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ハロゲン原子により置換されていてもよい）；アリールチオ基（このアリールチオ基はハロゲン原子及び $C_{1-6}$ アルキル基により置換されていてもよい）； $C_{1-6}$ アルキルチオ基（このアルキルチオ基は、モノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミン（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ハロゲン原子により置換されていてもよい）；アリールアミノ基（このアリールアミノ基はさらに $C_{1-6}$ アルキルによって置換されていてもよい）；モノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミン（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成してもよく、この環状アミノ基はさらに1～3個の異種原子を含んでいてもよい）により置換されていてもよい）；水酸基；モノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は環状アミノ基を形成していてもよく、この環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい）；ニトロ基； $C_{2-6}$ アルケニルオキシ基；または $C_{2-6}$ アルキニルオキシ基により置換されていてもよい）を表す、請求項46～48のいずれか一項に記載の化合物。

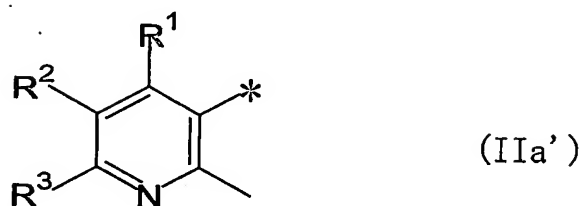
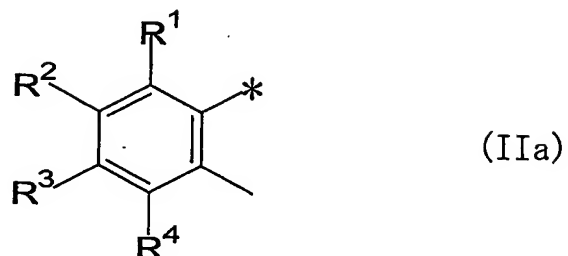
50. 式(I)が式(I-1)で表される、請求項1または2に記載の化合物。



(I-1)

(上記式中、A、R<sup>5</sup>、Z、および――は請求項1において定義された内容と同義である。)

51. Aが式(IIa)または式(IIa'):

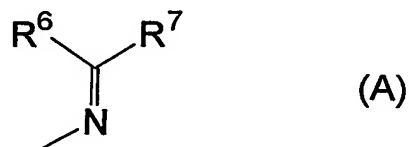


(上記式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、およびR<sup>4</sup>は、請求項3の式(IIa)および式(IIa')において定義された内容と同義である。)

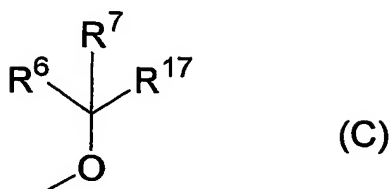
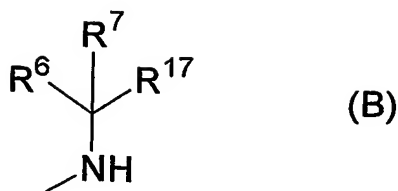
であり、

R<sup>5</sup>が、置換基を有してもよいC<sub>5-7</sub>シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)



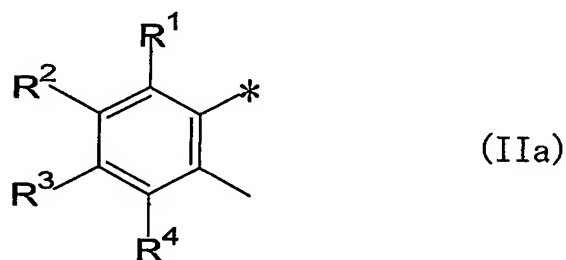
736



(上記式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す)

を表す、請求項50に記載の化合物。

52. Aが式(IIa) :



(上記式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ は、請求項3の式(IIa)において定義された内容と同義である。)

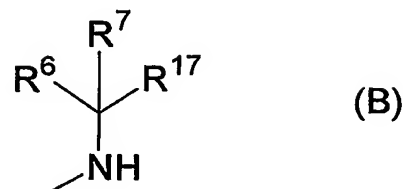
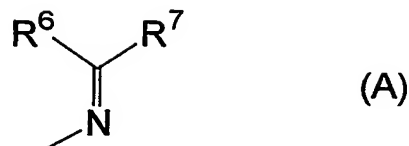
であり、

---が二重結合を表し、

$R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6

員複素環式基を表し、

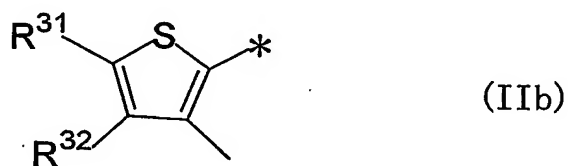
Zが基 (A) または (B)



(上記式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す)

を表す、請求項50に記載の化合物。

53. Aが式 (IIb) :



(上記式中、 $R^{31}$ および $R^{32}$ は、請求項17の式 (IIb) において定義された内容と同義である。)

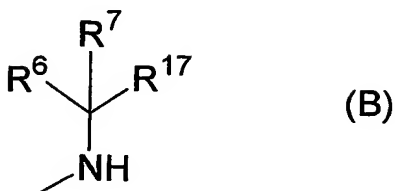
であり、

$R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

Zが基 (A) または (B)



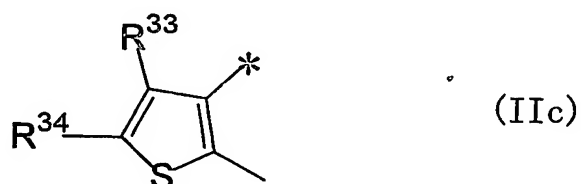
738



(上記式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す)

を表す、請求項50に記載の化合物。

54. Aが式(IIc) :



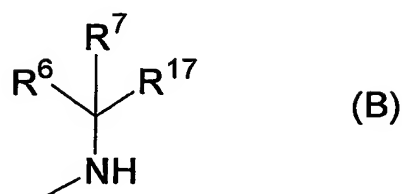
(上記式中、 $R^{33}$ および $R^{34}$ は、請求項17の式(IIc)において定義された内容と同義である。)

であり、

$R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

Zが基(A)または(B)

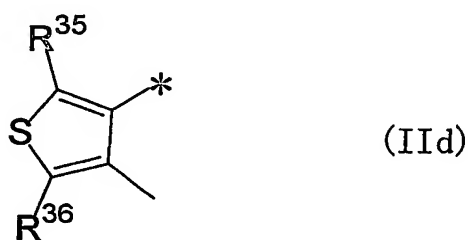
739



(上記式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す)

を表す、請求項50に記載の化合物。

55. Aが式(II d) :



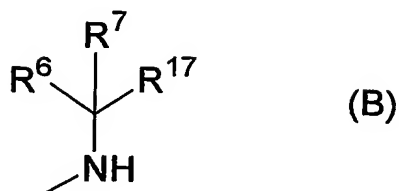
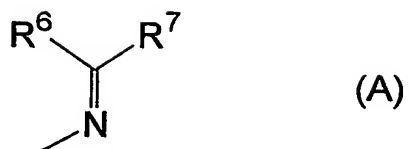
(上記式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ は、請求項17の式(II d)において定義された内容と同義である。)

であり、

$R^5$ が、置換基を有してもよい $C_{5-7}$ シクロアルキル基、置換基を有してもよいアリール基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

Zが基(A)または(B)

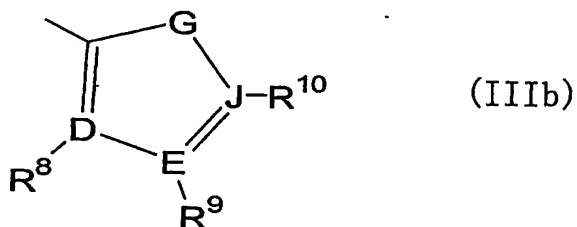
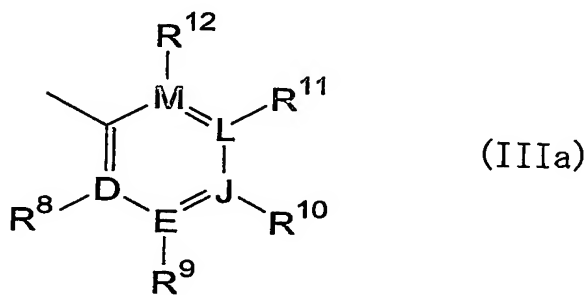
740



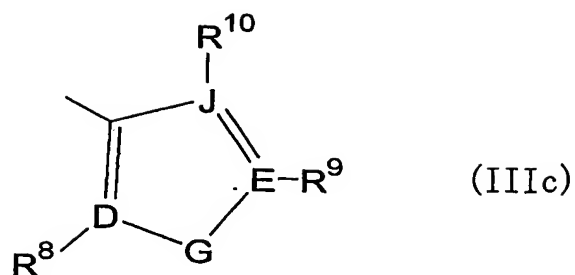
(上記式中、 $R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、 $R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、 $R^{17}$ が水素原子を表す)

を表す、請求項50に記載の化合物。

56.  $R^5$ が、式(IIIa)、式(IIIb)、または式(IIIc)

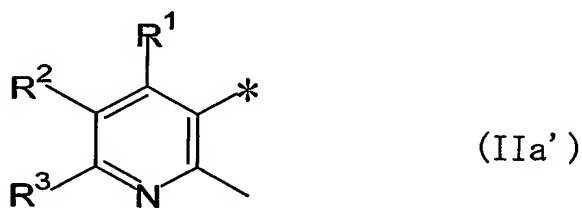
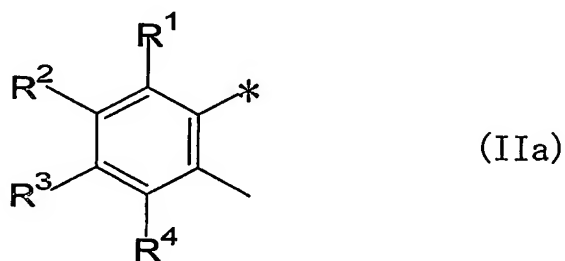


741



(上記式中、D、E、G、J、L、M、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ は、請求項29において定義された内容と同義である。) を表す、請求項51～55のいずれか一項に記載の化合物。

57. Aが式(IIa)または式(IIa')



を表し、

上記式中、

- (1)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が水素原子を表すか、
- (2)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ-アリーールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジアルキ

ルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基(ジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、

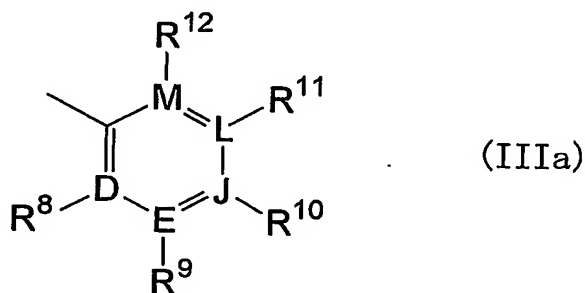
(3)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すか、

(4)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、これらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成するか、

(5)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよいモノまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は一緒になって置換基を有していてもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、あるいは

(6)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表し、

$R^5$ が式(IIIa)



を表し、

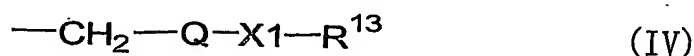
上記式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲ

ン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

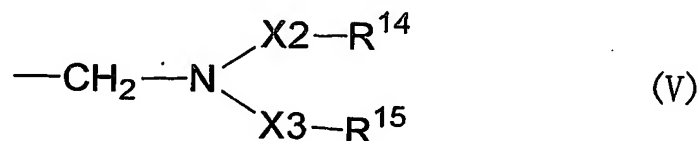
(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X 1、および $R^{13}$ は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

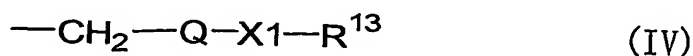
または式 (V) の基



(上記式中、X 2、X 3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

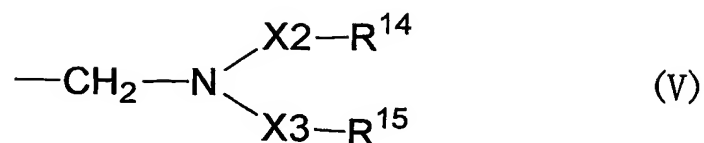
を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X<sup>1</sup>、およびR<sup>13</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

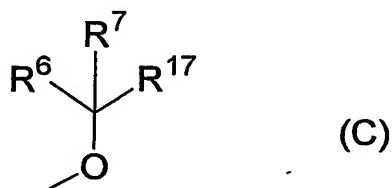
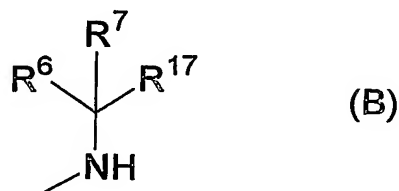
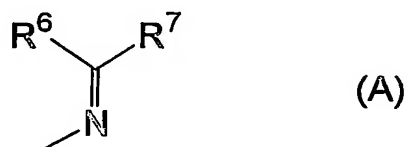
または式(V)の基



(上記式中、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)



を表し、

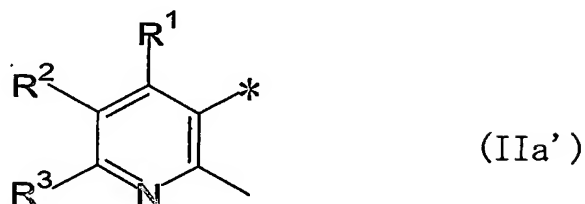
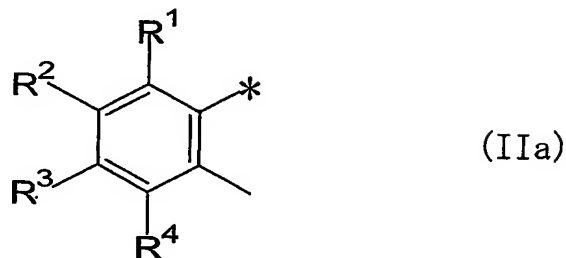
上記式中、

R<sup>6</sup>が水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を表し、

R<sup>7</sup>が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリールC<sub>1-6</sub>アルキル基、置換を有していてもよいアリールC<sub>2-6</sub>アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

$R^{17}$ が水素原子を表す  
請求項50に記載の化合物。

58. Aが式(IIa)または式(IIa') )



を表し、

上記式中、

- (1)  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、および $R^4$ が水素原子を表すか、
- (2)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方がハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基；置換基を有してもよいモノーまたはジアーリールアミノ基；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基(ジアルキルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)；置換基を有してもよいモノーまたはジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基(ジ- $C_{2-6}$ アルケニルアミノ基は一緒になって置換基を有してもよい不飽和環状アミノ基を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい)を表し、他方が水素原子を表すか、



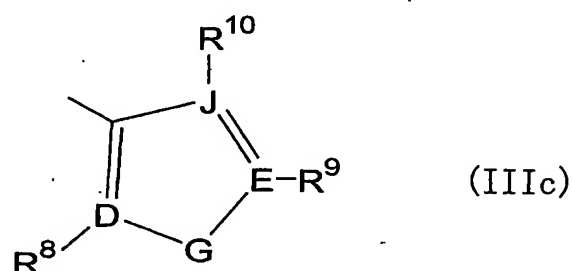
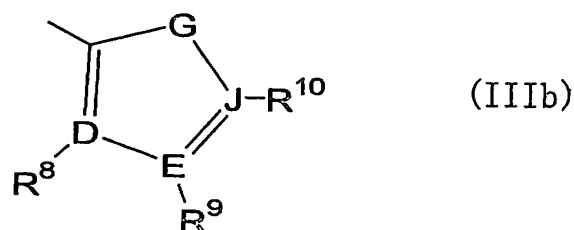
(3)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、同一または異なっているいてもよく、ハロゲン原子；水酸基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルキル基；置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表すか、あるいは

(4)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ が、これらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成するか、

(5)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよいモノまたはジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基（ジ- $C_{1-6}$ アルキルアミノ基は一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成してもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでもよい）を表し、他方が水素原子を表すか、あるいは

(6)  $R^1$ および $R^4$ が水素原子を表し、 $R^2$ および $R^3$ のいずれか一方が置換基を有してもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、他方が水素原子を表し、

$R^5$ が式 (IIIb) または式 (IIIc)



を表し、

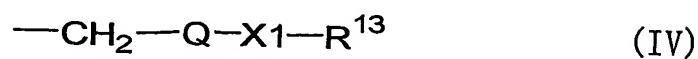
上記式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているいてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$

747

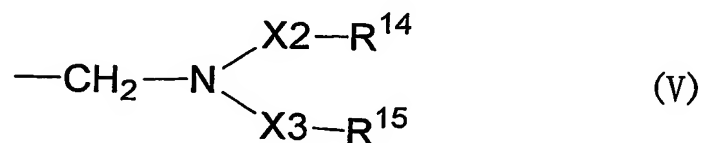
アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X 1、および $R^{13}$ は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

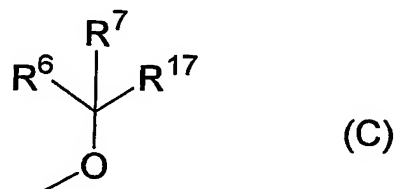
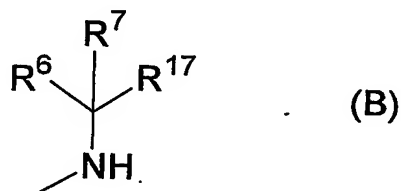
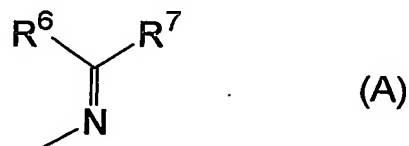
または式 (V) の基



(上記式中、X 2、X 3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基 (A)、基 (B)、または基 (C)



を表し、

上記式中、

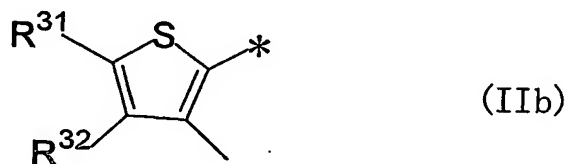
$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

$R^{17}$ が水素原子を表す

請求項50に記載の化合物。

59. Aが式(IIb)



を表し、

上記式中、

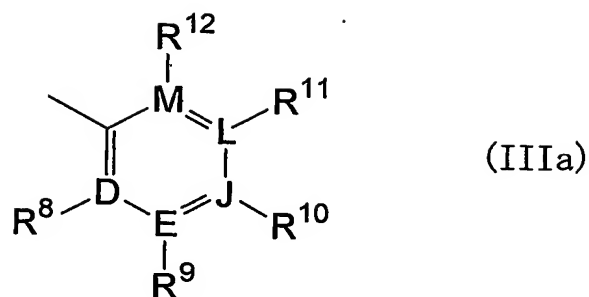
(i)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、

(ii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{31}$ と $R^{32}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5~7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(IIIa)



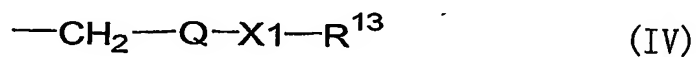
を表し、

上記式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

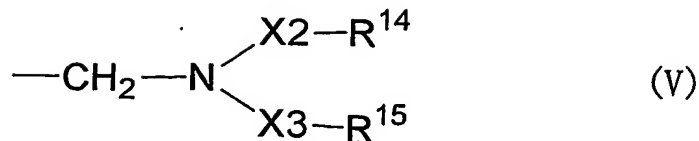
(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X1、および $R^{13}$ は請求項31において定義された内容と同義である。)

または式 (V) の基

750



(上記式中、X 2、X 3、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

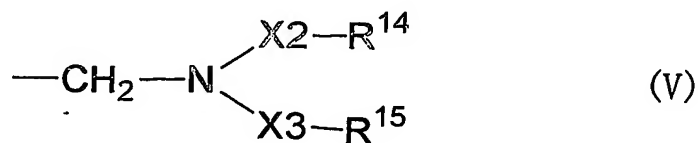
を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、およびR<sup>12</sup>が水素原子を表し、R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X 1、およびR<sup>13</sup>は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

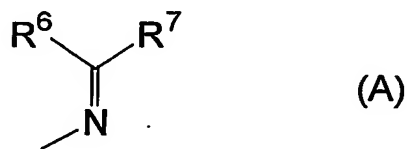
または式 (V) の基



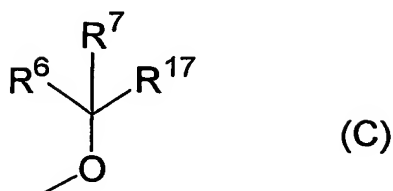
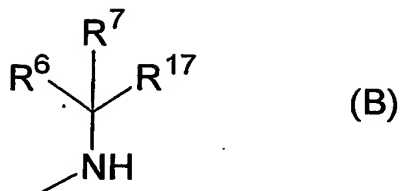
(上記式中、X 2、X 3、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基 (A)、基 (B)、または基 (C)



751



を表し、

上記式中、

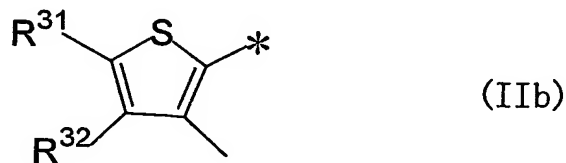
$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

$R^{17}$ が水素原子を表す

請求項50に記載の化合物。

60. Aが式 (IIb)



を表し、

上記式中、

(i)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が水素原子を表すか、

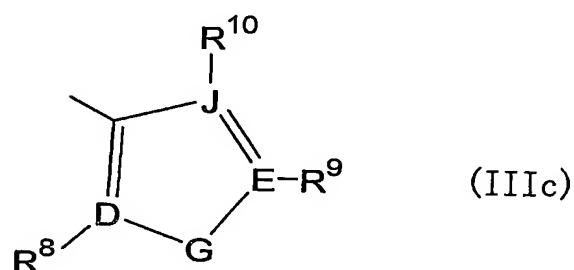
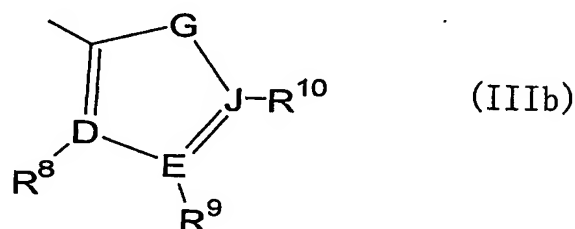
(ii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基 ( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ

基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{31}$ および $R^{32}$ が、同一または異なっているとしてもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{31}$ と $R^{32}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(IIIb)または式(IIIc)

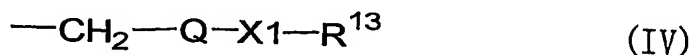


を表し、

上記式中、

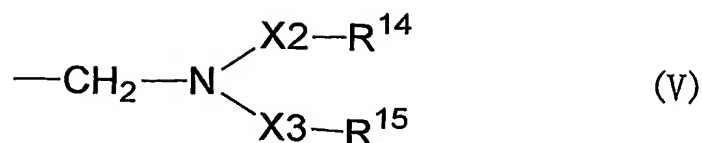
(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基



(上記式中、Q、X<sup>1</sup>、およびR<sup>13</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

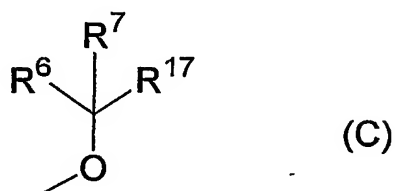
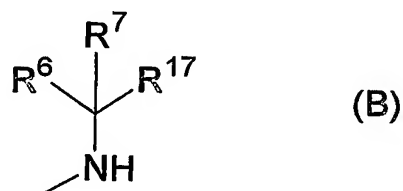
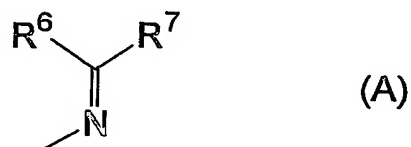
または式(V)の基



(上記式中、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)



を表し、

上記式中、

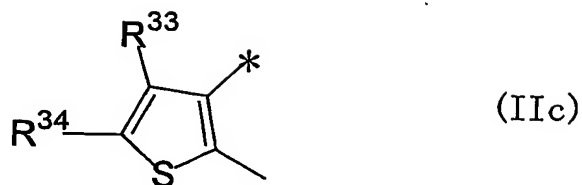
R<sup>6</sup>が水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を表し、

R<sup>7</sup>が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリールC<sub>1-6</sub>アルキル基、置換を有していてもよいアリールC<sub>2-6</sub>アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、



$R^{17}$ が水素原子を表す  
請求項50に記載の化合物。

61. Aが式(IIc)

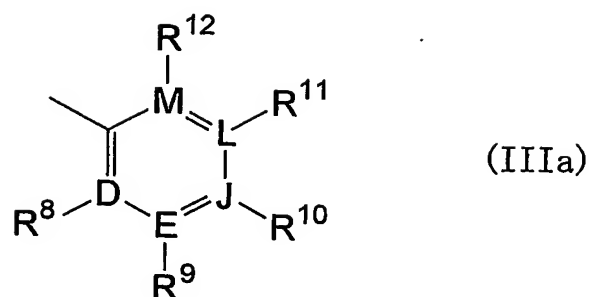


を表し、

上記式中、

- (i)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、
  - (ii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでもよい)を表すか、
  - (iii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が、同一または異なってもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1~3個の異種原子を含んでもよい)を表すか、あるいは
  - (iv)  $R^{33}$ と $R^{34}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5~7員炭素環を形成し、
- $R^5$ が式(IIIa)

755



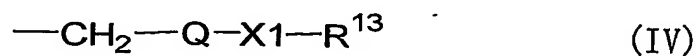
を表し、

上記式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

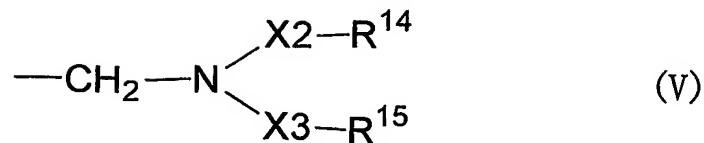
(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X1、および $R^{13}$ は請求項31において定義された内容と同義である。)

または式 (V) の基

756



(上記式中、X 2、X 3、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

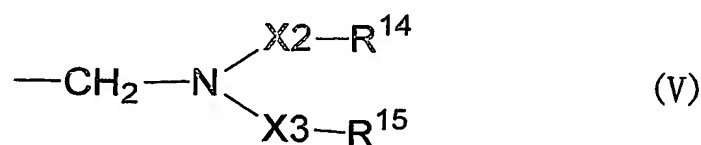
を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、およびR<sup>12</sup>が水素原子を表し、R<sup>10</sup>およびR<sup>11</sup>のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X 1、およびR<sup>13</sup>は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

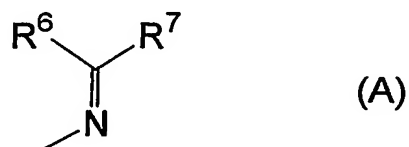
または式 (V) の基



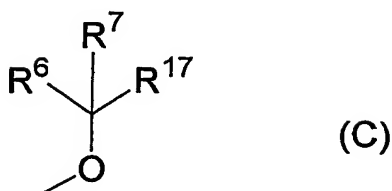
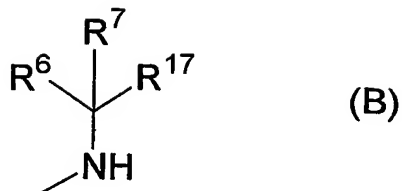
(上記式中、X 2、X 3、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基 (A)、基 (B)、または基 (C)



757



を表し、

上記式中、

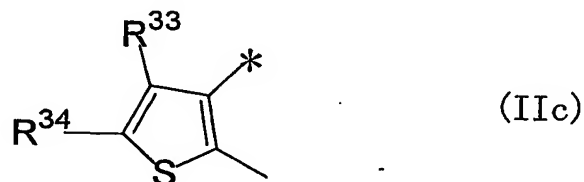
$R^6$ が水素原子または $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $C_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $C_{2-6}$ アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

$R^{17}$ が水素原子を表す

請求項50に記載の化合物。

62. Aが式(IIc)



を表し、

上記式中、

(i)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が水素原子を表すか、

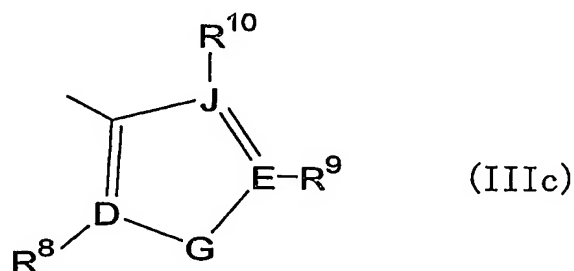
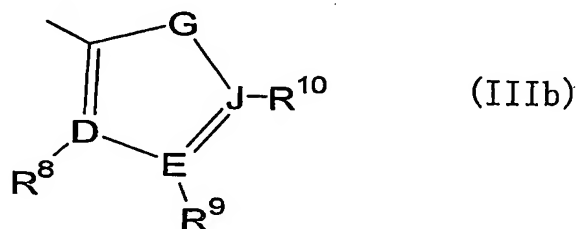
(ii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方が $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$

アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、

(iii)  $R^{33}$ および $R^{34}$ が、同一または異なっているとしてもよく、 $C_{1-6}$ アルキル基( $C_{1-6}$ アルキル基は、環状アミノ基を形成してもよいモノまたはジ $C_{1-6}$ アルキルアミノ基またはハロゲン原子により置換されていてもよく、環状アミノ基は更に1～3個の異種原子を含んでいてもよい)を表すか、あるいは

(iv)  $R^{33}$ と $R^{34}$ が、それらが結合している炭素原子と一緒に不飽和の5～7員炭素環を形成し、

$R^5$ が式(IIIb)または式(IIIc)



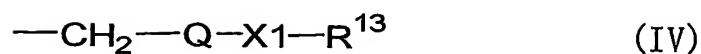
を表し、

上記式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているとしてもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

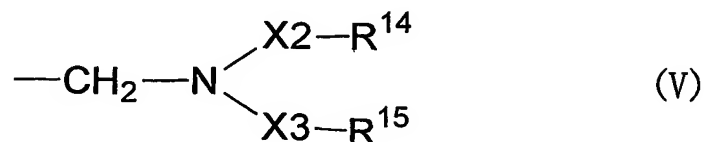
(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基

759



(上記式中、Q、X1、および $\text{R}^{13}$ は請求項31において定義された内容と同義である。)

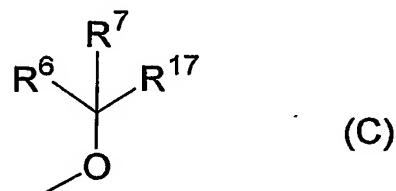
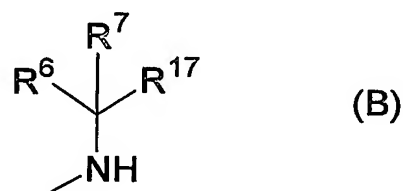
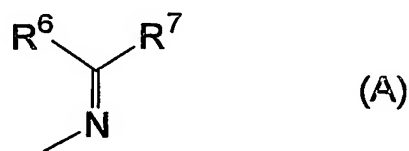
または式(V)の基



(上記式中、X2、X3、 $\text{R}^{14}$ 、および $\text{R}^{15}$ は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)



を表し、

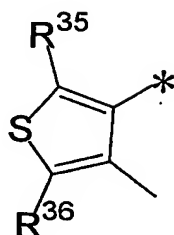
上記式中、

$\text{R}^6$ が水素原子または $\text{C}_{1-6}$ アルキル基を表し、

$\text{R}^7$ が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール $\text{C}_{1-6}$ アルキル基、置換を有していてもよいアリール $\text{C}_{2-6}$ アルケニル基、また

は置換基を有していてもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、  
 $R^{17}$ が水素原子を表す  
 請求項50に記載の化合物。

63. Aが式(II d)

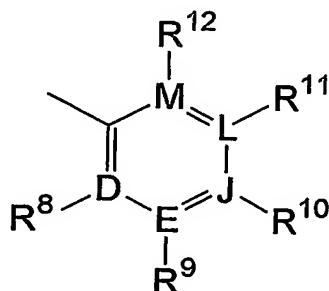


(II d)

を表し、

上記式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^5$ が式(III a)



(III a)

を表し、

上記式中、

(i) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なってもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ

基を表し、残りが水素原子を表すか、

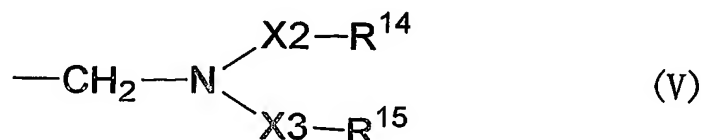
(ii) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、および $R^{12}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよく、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されているもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、

(iii) D、E、J、L、およびMが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基



(上記式中、Q、X 1、および $R^{13}$ は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

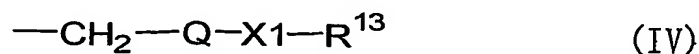
または式 (V) の基



(上記式中、X 2、X 3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は請求項 3 1 において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表すか、あるいは

(iv) D、E、J、L、およびMのいずれか一つまたは二つが窒素原子を表し、残りが炭素原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{12}$ が水素原子を表し、 $R^{10}$ および $R^{11}$ のうち一つが式 (IV) の基

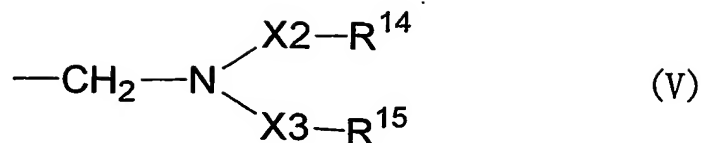


(上記式中、Q、X 1、および $R^{13}$ は請求項 3 1 において定義された内容と同



義である。)

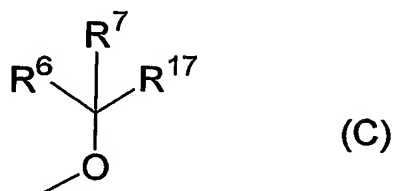
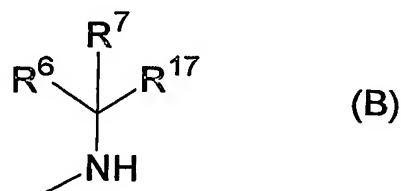
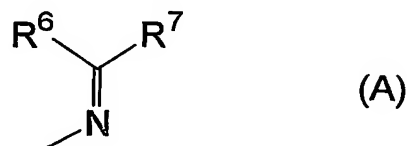
または式 (V) の基



(上記式中、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、R<sup>14</sup>、およびR<sup>15</sup>は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)



を表し、

上記式中、

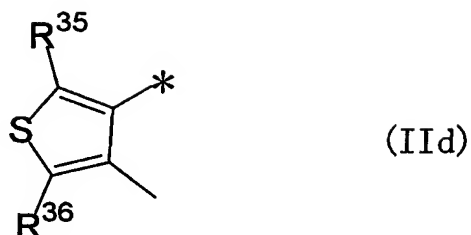
R<sup>6</sup>が水素原子またはC<sub>1-6</sub>アルキル基を表し、

R<sup>7</sup>が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有してもよいアリールC<sub>1-6</sub>アルキル基、置換を有してもよいアリールC<sub>2-6</sub>アルケニル基、または置換基を有してもよい飽和または不飽和の5または6員複素環式基を表し、

R<sup>17</sup>が水素原子を表す

請求項50に記載の化合物。

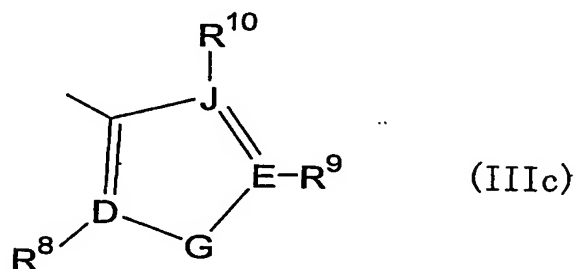
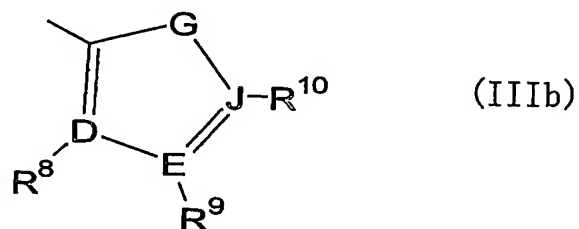
64. Aが式 (II d)



を表し、

上記式中、 $R^{35}$ および $R^{36}$ が水素原子を表すか、または $R^{35}$ および $R^{36}$ のいずれか一方が水素原子を表し、他方がハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基を表し、

$R^5$ が式 (III b) または式 (III c)



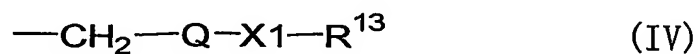
を表し、

上記式中、

(i) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つまたは二つが、同一または異なっているもよ

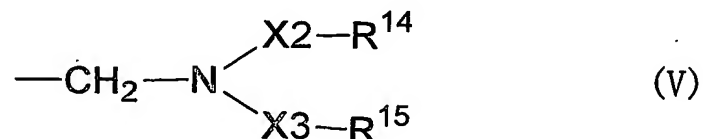
く、ハロゲン原子；ヒドロキシメチル基；ハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルキル基；またはハロゲン原子により置換されていてもよい $C_{1-6}$ アルコキシ基を表し、残りが水素原子を表すか、あるいは

(ii) D、E、およびJが炭素原子を表し、Gが酸素原子または硫黄原子を表し、 $R^8$ 、 $R^9$ 、および $R^{10}$ のうち一つが式(IV)の基



(上記式中、Q、X1、および $R^{13}$ は請求項31において定義された内容と同義である。)

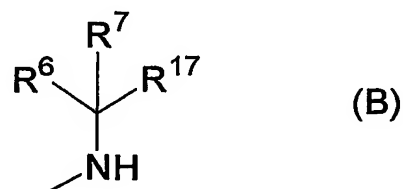
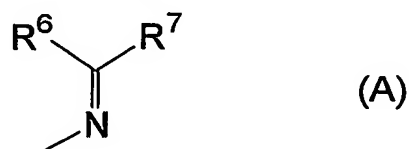
または式(V)の基



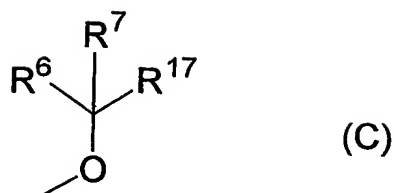
(上記式中、X2、X3、 $R^{14}$ 、および $R^{15}$ は請求項31において定義された内容と同義である。)

を表し、残りの基が水素原子を表し、

Zが基(A)、基(B)、または基(C)



765



を表し、

上記式中、

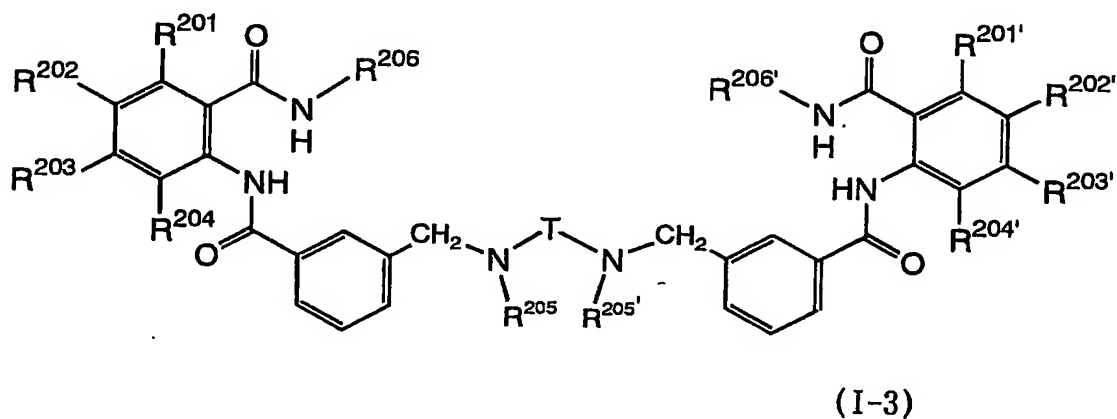
$R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、

$R^7$  が置換基を有してもよいアリール基、置換基を有していてもよいアリール  $C_{1-6}$  アルキル基、置換を有していてもよいアリール  $C_{2-6}$  アルケニル基、または置換基を有していてもよい飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基を表し、

$R^{17}$  が水素原子を表す

請求項 50 に記載の化合物。

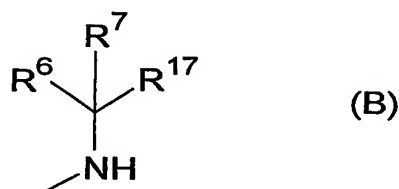
65. 式 (I-3) の化合物またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物。



(上記式中、 $R^{201}$ 、 $R^{202}$ 、 $R^{203}$ 、 $R^{204}$ 、 $R^{201'}$ 、 $R^{202'}$ 、 $R^{203'}$ 、および  $R^{204'}$  は、同一または異なってもよく、水素原子、ハロゲン原子、水酸基、 $C_{1-6}$  アルキル基、または  $C_{1-6}$  アルコキシ基を表し、

$R^{205}$  および  $R^{205'}$  は、同一または異なっているとしてもよく、水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、

$R^{206}$  および  $R^{206'}$  は、同一または異なっているとしてもよく、基 A または基 B



(上記式中、 $R^6$  が水素原子または  $C_{1-6}$  アルキル基を表し、 $R^7$  がアリール基または飽和または不飽和の 5 または 6 員複素環式基 (アリール基および複素環式基はハロゲン原子またはハロゲン原子により置換されていてもよい  $C_{1-6}$  アルキル基を表す)

を表し、

T は  $C_{2-8}$  アルキレン鎖を表す)

66. 請求項 1 ～ 65 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物を有効成分として含んでなる、医薬組成物。

67. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患の予防または治療に用いることができる、請求項 66 に記載の医薬組成物。

68. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、高リン血症である、請求項 67 に記載の医薬組成物。

69. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、腎不全および慢性腎不全である、請求項67に記載の医薬組成物。

70. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、二次性副甲状腺機能亢進症および原発性副甲状腺機能亢進症並びにこれらに関連する疾患である、請求項67に記載の医薬組成物。

71. 二次性副甲状腺機能亢進症に関連する疾患が、腎性骨異常栄養症、PTH増加またはビタミンD低下により生ずる中枢・末梢神経障害、貧血、心筋障害、高脂血症、糖代謝異常、皮膚掻痒、腱断裂、性機能異常、筋肉障害、皮膚虚血性潰瘍、成長遅延、心伝導障害、肺拡張障害、免疫不全、骨・関節痛、骨変形、または骨折である、請求項70に記載の医薬組成物。

72. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウム・リン代謝異常疾患（例えば、代謝性骨疾患）である、請求項67に記載の医薬組成物。

73. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患である、請求項67に記載の医薬組成物。

74. カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患が、透析患者における心血管系の石灰化、加齢による動脈硬化、糖尿病性血管症、軟部組織石灰化、転移性石灰化、異所性石灰化、red eye、関節痛、筋肉痛、皮膚掻痒、心伝導障害、肺拡張障害、狭心症、心筋梗塞、または心雑音や弁膜症による心不全である、請求項73に記載の医薬組成物。

75. 請求項1～65のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的

に許容できる塩もしくは溶媒和物を含んでなる、血清リン濃度低下剤。

76. 請求項1～65のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物を含んでなる、リン酸輸送阻害剤。

77. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療に用いられる医薬の製造のための、請求項1～65のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

78. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、高リン血症である、請求項77に記載の使用。

79. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、腎不全および慢性腎不全である、請求項77に記載の使用。

80. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、二次性副甲状腺機能亢進症および原発性副甲状腺機能亢進症並びにこれらに関連する疾患である、請求項77に記載の使用。

81. 二次性副甲状腺機能亢進症に関連する疾患が、腎性骨異常栄養症、PTH増加またはビタミンD低下により生ずる中枢・末梢神経障害、貧血、心筋障害、高脂血症、糖代謝異常、皮膚掻痒、腱断裂、性機能異常、筋肉障害、皮膚虚血性潰瘍、成長遅延、心伝導障害、肺拡張障害、免疫不全、骨・関節痛、骨変形、または骨折である、請求項80に記載の使用。

82. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウム・リン代謝異常疾患（例えば、代謝性骨疾患）である、請求項77に記載の使用。

83. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患である、請求項77に記載の使用。

84. カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患が、透析患者における心血管系の石灰化、加齢による動脈硬化、糖尿病性血管症、軟部組織石灰化、転移性石灰化、異所性石灰化、red eye、関節痛、筋肉痛、皮膚掻痒、心伝導障害、肺拡散障害、狭心症、心筋梗塞、または心雑音や弁膜症による心不全である、請求項83に記載の使用。

85. 血清リン濃度低下剤の製造のための、請求項1～65のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

86. リン酸輸送阻害剤の製造のための、請求項1～65のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

87. 請求項1～65のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上有効である疾患の予防または治療方法。

88. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、高リン血症である、請求項87に記載の方法。

89. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、腎不全および慢性腎不全である、請求項87に記載の方法。

90. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、二次性副甲状腺機能亢進症および原発性副甲状腺機能亢進症並び



にこれらに関連する疾患である、請求項 87 に記載の方法。

91. 二次性副甲状腺機能亢進症に関連する疾患が、腎性骨異栄養症、PTH 増加またはビタミン D 低下により生ずる中枢・末梢神経障害、貧血、心筋障害、高脂血症、糖代謝異常、皮膚掻痒、腱断裂、性機能異常、筋肉障害、皮膚虚血性潰瘍、成長遅延、心伝導障害、肺拡散障害、免疫不全、骨・関節痛、骨変形、または骨折である、請求項 90 に記載の方法。

92. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウム・リン代謝異常疾患（例えば、代謝性骨疾患）である、請求項 87 に記載の方法。

93. 血清リン低下作用またはリン酸輸送の阻害が治療上または予防上有効である疾患が、カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患である、請求項 87 に記載の方法。

94. カルシウムおよび／またはリン積の抑制が治療上有効である疾患が、透析患者における心血管系の石灰化、加齢による動脈硬化、糖尿病性血管症、軟部組織石灰化、転移性石灰化、異所性石灰化、red eye、関節痛、筋肉痛、皮膚掻痒、心伝導障害、肺拡散障害、狭心症、心筋梗塞、または心雑音や弁膜症による心不全である、請求項 93 に記載の方法。

95. 請求項 1～65 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、血流中の血清リン濃度を低下させる方法。

96. 請求項 1～65 のいずれか一項に記載の化合物またはそれらの薬学的に許容できる塩もしくは溶媒和物の治療上または予防上の有効量を哺乳類に投与する工程を含んでなる、生体内におけるリン酸輸送を阻害する方法。

1/4

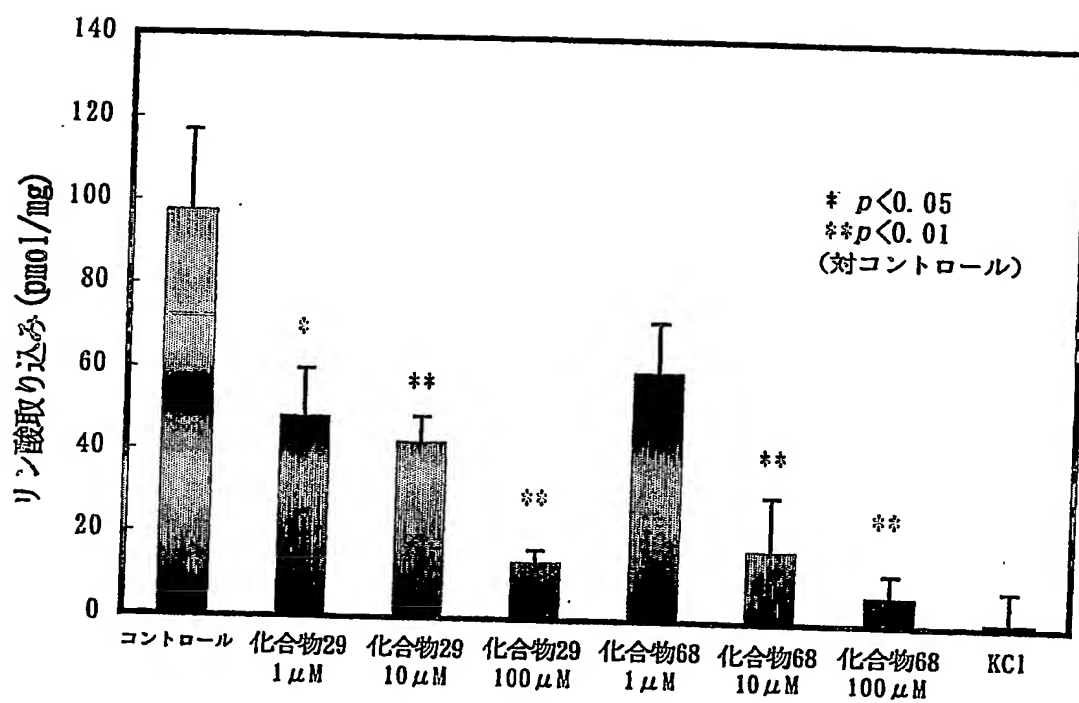


FIG. 1

2/4

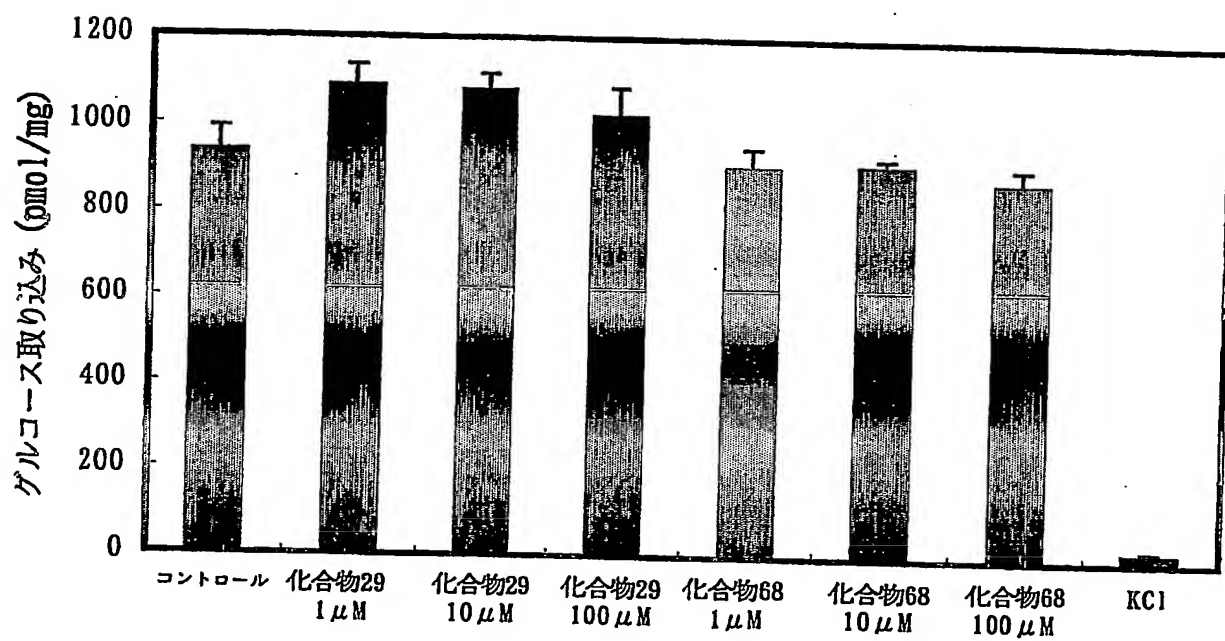


FIG. 2

3/4

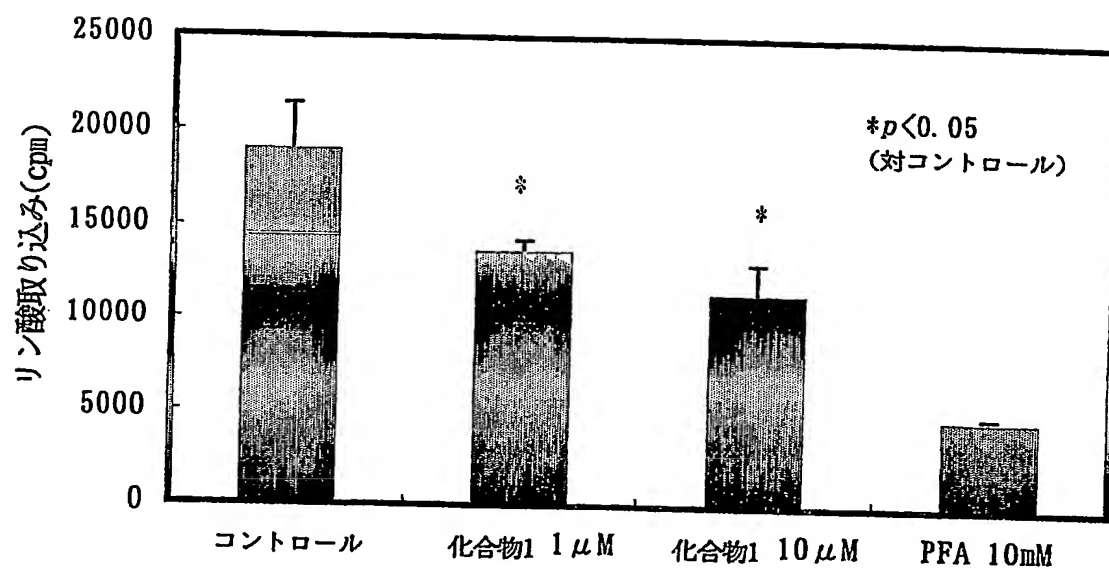


FIG. 3

4/4

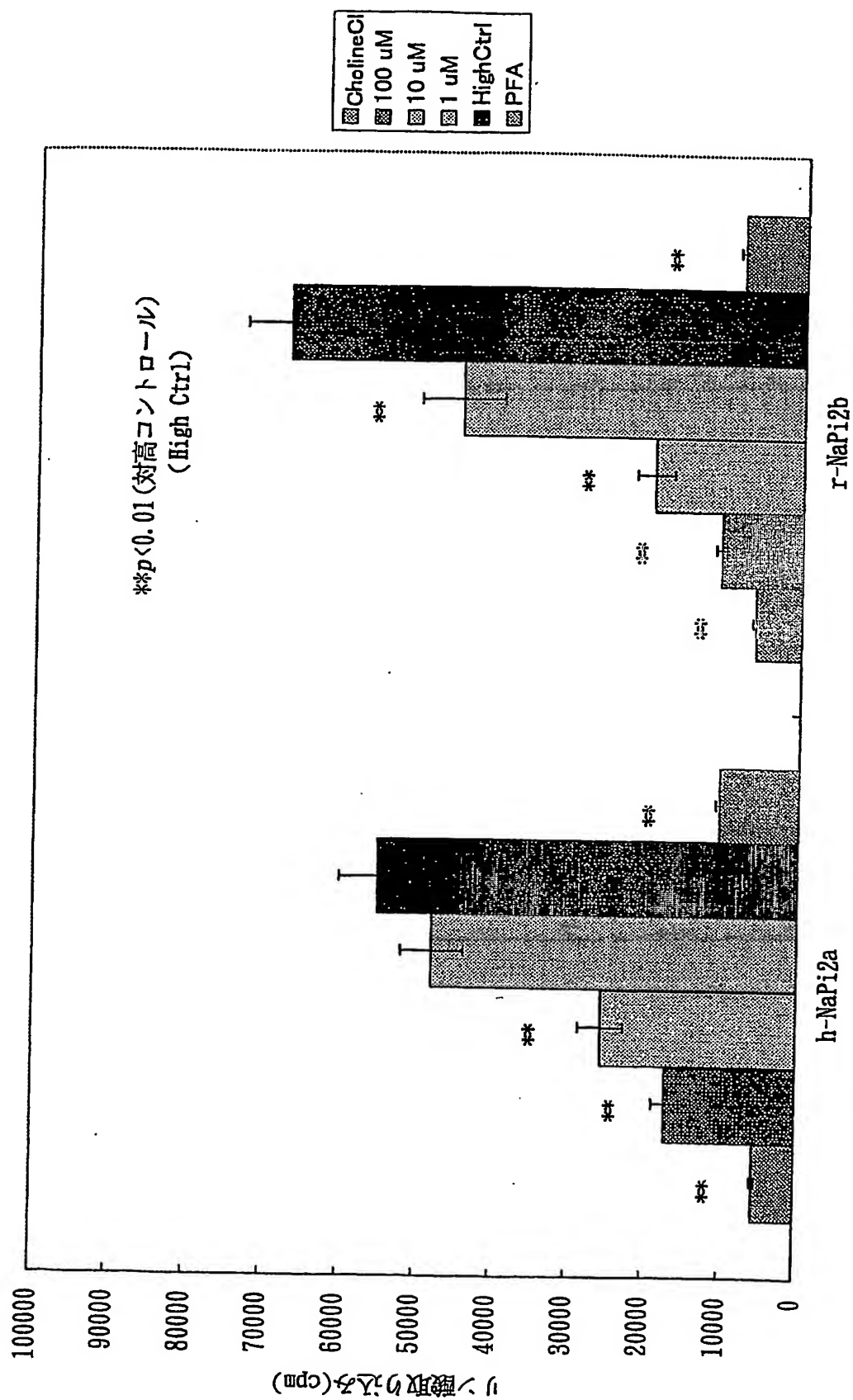


FIG. 4

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/004427

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07C251/80, 251/86, 317/44, 323/25, 323/60, 323/66,  
C07D207/18, 211/46, 211/58, 211/60, 213/32, 213/44, 213/81,  
231/04, 241/04, 243/08, 261/18, 249/12, 257/04, 295/08, 295/12,  
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07C251/80, 251/86, 317/44, 323/25, 323/60, 323/66,  
C07D207/18, 211/46, 211/58, 211/60, 213/32, 213/44, 213/81,  
231/04, 241/04, 243/08, 261/18, 249/12, 257/04, 295/08, 295/12,

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)  
CA (STN), REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 00/53208 A2 (NPS ALLELIX CORP.), 14 September, 2000 (14.09.00), Full text (Family: none)	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56, 66
X	HODA A. ABDEL-HAMID, SAYED A. SHIBA, ABDEL-MOMEN A. EL-KHAMRY, AHMED S.A. YOUSSEF, "SYNTHESIS OF SOME BIOLOGICALLY ACTIVE HETEROCYCLES. REACTIONS OF THE HYDRAZIDE OF 2'-THIENOYL ANTHRANIC ACID AND ITS 3,5-DIBROMO DERIVATIVE", Phosphorus, Sulfur and Silicon and the Related Elements, 1982, Vol.72, No.1-4, pages 237 to 247	1-8, 16, 24, 26-30, 32, 36, 46-52, 56, 66

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
05 July, 2004 (05.07.04)

Date of mailing of the international search report  
10 August, 2004 (10.08.04)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/004427

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	JP 2-277073 A (Dainichiseika Color & Chemicals Mfg. Co., Ltd.), 13 November, 1990 (13.11.90), Full text & EP 613055 A1	1-8, 16, 24, 25, 46-52
X	DJORDIE VLAOVIC, BOZIDAR LJ. MILIC, KENNETH MACKENZIE, "Modified Procedure for the Preparation of 5-Nitro-2-furylmethyline Diacetate and Its Use in the Synthesis of Some Novel (5-Nitro-2-furyl) azomethines via 5-Nitro-2-furaldehyde", Journal of Chemical Research, Synopses, 1989, No.6, pages 156 to 157	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	H.A. ZAHER, H. JAHINE, Y. AKENOOKH, Z. EL-GENDY, "Reactions of 2-p-Anisyl-3(4H), 1-benzoxazin-4-one with ammonia, Primary Amines, Hydrazine, Phenylhydrazine & Grignard Reagents", Indian Journal of Chemistry, 1974, Vol.12, No.11, pages 1212 to 1215	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 38, 46-52, 56, 57
X	FR 2168136 A (FERLUI), 31 August, 1973 (31.08.73), Full text (Family: none)	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 38, 46-52, 56, 57, 66
X	S.G. ABDEL-HAMIDE, "Synthesis and Chemistry of some Novel 3-Heteroaryl-quinazolin-4-one Derivatives and their Antimicrobial Effects", Journal of the Indian Chemical Society, 1997, Vol.74, No.8, pages 619 to 623	1-7, 9, 10, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	M.B. DESHMUKH, D.S. DESHMUKH, "Synthesis and Biological Activity of some New Quinazolinyl Thazolidinones and Azetidiones", Journal of the Indian Chemical Society, 1995, Vol.72, No.12, pages 847 to 848	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	Mohamed F. Abdel-Megeed, A. Teniou, "Magnetic Anisotropic Effect As Demonstrated by High Resolution PMR in Some Benzoxazinones, Quinazolinones and Their Thino Analogues", Spectroscopy Letters, 1987, Vol.20, No.8, p.583-390	1-7, 9, 10, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	Padi PRATAP REDDY, Cheppala KISTA REDDY, Padala SATYANARAYANAN. REDDDY, "Reaction of 2-Amino benzohydrazides with Schiff Bases. A New Route to 3-Benzylideneamino-4(3H)-quinazolines and 2-[2-(methylamino-phenyl)-5-aryl-1,3,4-oxadiazoles", Bulletin of the Chemical Society of Japan, 1986, Vol.59, No.5, pages 1575 to 1580	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 38, 46-52, 56, 57

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/004427

## C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	M.I. HUSAIN, SARVESHWAR SHUKLA, "Synthesis & Biological Activities of 3-(2'-Aryl-4'-oxothazolidin-3'-yl)-2-phenylquinazolin-4(3H)-ones", Indian Journal of Chemistry, Section B:Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 1986, Vol.25B, No.5, pages 545 to 548	1-8,16,24, 25,27-30,32, 34,46-52,56, 66
X	Eisaku HAYASHI et al., "Kanzo Hydrazide Kozo o Fukumu Fukusokan Kagobutsu no Gosei to Sono Koshuyosei ni Tsuite", Journal of the Pharmaceutical Society of Japan, 1978 Nen, Vol.98, No.11, pages 1560 to 1565	1-8,16,24, 25,27-30,32, 34,38,46-52, 56,57,66
X	A.M. ABBADY, M. ANWAR, M.F. ABDEL-MEGEED, "2-ARYL-3-AMINE-4-QUINAZOLINONES", Acta Chimica.Academiae Scientiarum Hungaricae, 1976, Vol.91, No.3, pages 341 to 349	1-8,16,24, 25,27-30,32, 34,38,46-52, 56,57,66
X	M.M. El Kerdawy, M.Y. Yousif, A.A. El Emam, M.A. Moustafa, M.A. El-sherbeny, "Synthesis of Cartain Benzoxazine and Quinazoline Derivatives as Potential Antiinflammatory Agents", Egyptian Journal of Pharmaceutical Sciences, 1994, Vol.35, No.1-6, pages 1 to 20	1-7,9,10,16, 24,26-30,32, 36,46-52,56
X	M. Fekry Ismail, Abdel Momen A. El-Khamry, Fekria S. Sayed, Samir A. Emara, "Reaction of 6,8-Dibromo-2-Phenyl-3,1-Benzoxazin-4-One with Hydrazines, Schiff Bases and Azines", Egyptian Journal of Chemistry, 1991, Vol.32, No.4, pages 433 to 444	1-7,24,25, 27-30,32,34, 46-52,56
P,X	Manjusha Verma, Sundaram Singh, K.M. Singh, "SYNTHESIS OF SOME NEW BENZOXAZINE DERIVATIVES OF BIOLOGICAL INTEREST, Heterocyclic Communications, 2003, Vol.9, No.5, pages 499 to 502	1-8,16,24, 25,27-30,32, 34,38,46-52, 56,57



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/004427

## Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 87-96  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
Claims 87-96 fall under the category of methods for treatment of the human body by therapy and relate to a subject matter for which this International Searching Authority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a)(i) of the PCT and (continued to extra sheet)
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

## Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

Compounds which have inhibitory activity against a sodium-dependent phosphoric acid transporter and have the partial chemical structure "-C-N-(benzene ring)-CO-N" are known (*Journal of Laboratory and Clinical Medicine*, 1983, Vol. 101, No. 2, p. 308-316).

In view of this, the technical feature "C-N-(ring A)-CO-N" common to the choices in claim 1 and other claims cannot be regarded as "a special technical feature (a technical feature which clearly shows a contribution to the prior art)" common thereto.

This means that claim 1 and other claims involve inventions which have no technical relationship involving (continued to extra sheet)

1. ☒ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

### Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
- ☒ No protest accompanied the payment of additional search fees.

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2004/004427

## Continuation of A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER (International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> 295/18, 307/68, 307/52, 333/38, 403/12, 405/12, 409/12, 491/10, A61K31/167, 31/341, 31/381, 31/40, 31/41, 31/415, 31/4196, 31/42, 31/4402, 31/4406, 31/4409, 31/443, 31/445, 31/4535, 31/4545, 31/455, 31/495, 31/496, 31/517, 31/519, 31/5375, A61P3/06, 3/10, 5/18, 5/20, 7/06, 9/04, 11/00, 13/12, 15/10, 17/04, 19/02, 19/08, 21/00, 25/02, 37/00, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC)

## Continuation of B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (International Patent Classification (IPC))

Int.Cl<sup>7</sup> 295/18, 307/68, 307/52, 333/38, 403/12, 405/12, 409/12, 491/10, A61K31/167, 31/341, 31/381, 31/40, 31/41, 31/415, 31/4196, 31/42, 31/4402, 31/4406, 31/4409, 31/443, 31/445, 31/4535, 31/4545, 31/455, 31/495, 31/496, 31/517, 31/519, 31/5375, A61P3/06, 3/10, 5/18, 5/20, 7/06, 9/04, 11/00, 13/12, 15/10, 17/04, 19/02, 19/08, 21/00, 25/02, 37/00, 43/00

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

## Continuation of Box No.II-1 of continuation of first sheet(2)

Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT, to search.

## Continuation of Box No.III of continuation of first sheet(2)

a special technical feature common thereto and are described in an alternative way.

(With respect to scope of international search)

Neither a Production Example for producing "a compound in which R<sup>5</sup> is alkyl, alkoxy, etc.", "a compound in which R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> each is hydrogen, alkyl, alkenyl, aryl, etc.", and the like nor test results which show that these compounds have inhibitory activity against a sodium-dependent phosphoric acid transporter are specifically described in the description.

The compounds which have the partial chemical structure "C-N-(benzene ring)-CO-N" and have inhibitory activity against a sodium-dependent phosphoric acid transporter and which are known to persons skilled in the art are limited to those shown in *Journal of Laboratory and Clinical Medicine*, 1983, Vol. 101, No. 2, p. 308-316. That "the compound in which R<sup>5</sup> is alkyl, alkoxy, etc.", "the compound in which R<sup>6</sup> and R<sup>7</sup> each is hydrogen, alkyl, alkenyl, aryl, etc.", and the like have inhibitory activity against a sodium-dependent phosphoric acid transporter cannot be regarded as a matter of technical common sense for persons skilled in the art.

Furthermore, the compounds which can interact with a receptor are generally limited to ones having specific sizes/chemical structures, functional groups, and properties (electrical properties including polarity and ionicity, hydrophilicity/hydrophobicity, etc.).

It cannot hence be presumed that "the compound in which  $R^5$  is alkyl, alkoxy, etc.", "the compound in which  $R^6$  and  $R^7$  each is hydrogen, alkyl, alkenyl, aryl, etc.", and the like have the same inhibitory activity against a sodium-dependent phosphoric acid transporter as the specific compounds shown in Examples.

Consequently, all the compounds claimed in claim 1 and other claims cannot be sufficiently supported by the description.

Since claim 1 and other claims are not sufficiently supported by the description, the relevance of the subject matters of these claims to the prior art cannot be judged (with respect to an inventive step).

Therefore, an international search report was made only for the following compounds (1a), (1b), (2), and (3), which are sufficiently supported by the description, and for medicines, etc. each containing any of these compounds as an active ingredient (a search was made through prior art documents with respect to all the compounds shown in the Examples).

(1a) Those in which  $Z$  is  $-N=CR^6R^7$ ,  $A$  is an optionally substituted, 5- to 9-membered, unsaturated carbocycle part or 5- to 9-membered, unsaturated heterocycle part,  $R^5$  is optionally substituted aryl, heterocyclic group, or cycloalkyl, one of  $R^6$  and  $R^7$  is hydrogen or alkyl and the other is optionally substituted aryl, arylalkenyl, or heterocyclic group,  $R^{101}$  and  $R^{102}$  in combination represent  $=O$ , and  $R^{103}$  and  $R^{104}$  each is hydrogen.

(1b) Those in which  $Z$  is  $-N=CR^6R^7$ ,  $A$  is an optionally substituted, benzene ring or thiophene ring,  $R^5$  is optionally substituted phenyl, one of  $R^6$  and  $R^7$  is hydrogen and the other is optionally substituted phenyl,  $R^{101}$  and  $R^{104}$  in combination represent a bond, and  $R^{102}$  and  $R^{103}$  in combination represent a bond.

(2) Those in which  $Z$  is  $-NH-CR^6R^7R^{17}$ ,  $A$  is an optionally substituted, benzene ring or thiophene ring,  $R^5$  is optionally substituted phenyl or pyridyl,  $R^{17}$  is hydrogen, one of  $R^6$  and  $R^7$  is hydrogen and the other is optionally substituted phenyl,  $R^{101}$  and  $R^{102}$  in combination represent  $=O$ , and  $R^{103}$  and  $R^{104}$  each is hydrogen.

(3) Those in which  $Z$  is  $-O-CR^6R^7R^{17}$ ,  $A$  and  $R^5$  each is optionally substituted phenyl,  $R^{17}$  is hydrogen, one of  $R^6$  and  $R^7$  is hydrogen and the other is optionally substituted phenyl,  $R^{101}$  and  $R^{102}$  in combination represent  $=O$ , and  $R^{103}$  and  $R^{104}$  each is hydrogen.

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. C07C251/80, 251/86, 317/44, 323/25, 323/60, 323/66, C07D207/18, 211/46, 211/58, 211/60, 213/32, 213/44, 213/81, 231/04, 241/04, 243/08, 261/18, 249/12, 257/04, 295/08, 295/12, 295/18, 307/68, 307/52, 333/38, 403/12, 405/12, 409/12, 491/10 (最終頁に続く)

## B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl. C07C251/80, 251/86, 317/44, 323/25, 323/60, 323/66, C07D207/18, 211/46, 211/58, 211/60, 213/32, 213/44, 213/81, 231/04, 241/04, 243/08, 261/18, 249/12, 257/04, 295/08, 295/12, 295/18, 307/68, 307/52, 333/38, 403/12, 405/12, 409/12, 491/10 (最終頁に続く)

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使った電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN)

REGISTRY (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO 00/53208 A2 (NPS ALLELIX CORP.) 2000.09.14 全文 (ファミリーなし)	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56, 66
X	HODA A. ABDEL-HAMID, SAYED A. SHIBA, ABDEL-MOMEN A. EL-KHAMRY, AHMED S. A. YOUSSEF, "SYNTHESIS OF SOME BIOLOGICALLY ACTIVE HETERO CYCLES. REACTIONS OF THE HYDRAZIDE OF 2'-THIENOYL ANTHRANIC ACID AND ITS 3,5-DIBROMO DERIVATIVE", Phosphorus, Sulfur and Silicon and the Related Elements, 1982, Vol. 72, No. 1-4, p. 237-247	1-8, 16, 24, 26-30, 32, 36, 46-52, 56, 66

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

05.07.2004

国際調査報告の発送日

10.8.2004

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

吉住 和之

4H

9165

電話番号 03-3581-1101 内線 3443

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	J P 2-277073 A (大日本精化工業株式会社) 1990. 11. 13 全文 & EP 613055 A1	1-8, 16, 24, 25, 46-52
X	DJORDIE VLAOVIC, BOZIDAR LJ. MILIC, KENNETH MACKENZIE, "Modified Procedure for the Preparation of 5-Nitro-2-furylmethylene Diacetate and Its Use in the Synthesis of Some Novel (5-Nitro-2-furyl)azomethines via 5-Nitro-2-furaldehyde", Journal of Chemical Research, Synopses, 1989, No. 6, p. 156-157	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	H. A. ZAHER, H. JAHINE, Y. AKENOOKH, Z. EL-GENDY, "Reactions of 2-p-Anisyl-3(4H), 1-benzoxazin-4-one with ammonia, Primary Amines, Hydrazine, Phenylhydrazine & Grignard Reagents", Indian Journal of Chemistry, 1974, Vol. 12, No. 11, p. 1212-1215	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 38, 46-52, 56, 57
X	FR 2168136 A (FERLUI) 1973. 08. 31 全文 (ファミリーなし)	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 38, 46-52, 56, 57, 66
X	S. G. ABDEL-HAMIDE, "Synthesis and Chemistry of some Novel 3-Heteroaryl-quinazolin-4-one Derivatives and their Antimicrobial Effects", Journal of the Indian Chemical Society, 1997, Vol. 74, No. 8, p. 619-623	1-7, 9, 10, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	M. B. DESHMUKH, D. S. DESHMUKH, "Synthesis and Biological Activity of some New Quinazolinyl Thazolidinones and Azetidinones", Journal of the Indian Chemical Society, 1995, Vol. 72, No. 12, p. 847-848	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	Mohamed F. Abdel-Megeed, A. Teniou, "Magnetic Anisotropic Effect As Demonstrated by High Resolution PMR in Some Benzoxazinones, Quinazolinones and Their Thiono Analogues", Spectroscopy Letters, 1987, Vol. 20, No. 8, p. 583-390	1-7, 9, 10, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 46-52, 56
X	Padi PRATAP REDDY, Cheppala KISTA REDDY, Padala SATYANARAYANA N. REDDDY, "Reaction of 2-Aminobenzohydrazides with Schiff Bases. A New Route to 3-Benzylideneamino-4(3H)-quinazolines and 2-[2-(methylamino)-phenyl]-5-aryl-1,3,4-oxadiazoles", Bulletin of the Chemical Society of Japan, 1986, Vol. 59, No. 5, p. 1575-1580	1-8, 16, 24, 25, 27-30, 32, 34, 38, 46-52, 56, 57

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	M. I. HUSAIN, SARVESHWAR SHUKLA, "Synthesis & Biological Activities of 3-(2'-Aryl-4'-oxothazolidin-3'-yl)-2-phenylquinazolin-4(3H)-ones", Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry, 1986, Vol. 25B, No. 5, p. 545-548	1-8, 16, 24, 2 5, 27-30, 32, 3 4, 46-52, 56, 6 6
X	林英作ほか13名、「環状ヒドラジド構造を含む複素環化合物の合成とその抗腫瘍性について」薬学雑誌、1978年、第98巻、第11号、第1560-1565頁	1-8, 16, 24, 2 5, 27-30, 32, 3 4, 38, 46-52, 5 6, 57, 66
X	A. M. ABBADY, M. ANWAR, M. F. ABDEL-MEGEED, "2-ARYL-3-AMINE-4-QUINAZOLINONES", Acta Chimica Academiae Scientiarum Hungaricae, 1976, Vol. 91, No. 3, p. 341-349	1-8, 16, 24, 2 5, 27-30, 32, 3 4, 38, 46-52, 5 6, 57, 66
X	M. M. El Kerdawy, M. Y. Yousif, A. A. El Emam, M. A. Moustafa, M. A. El-sherbeny, "Synthesis of Certain Benzoxazine and Quinazoline Derivatives as Potential Antiinflammatory Agents", Egyptian Journal of Pharmaceutical Sciences, 1994, Vol. 35, No. 1-6, p. 1-20	1-7, 9, 10, 16, 24, 26-30, 32, 36, 46-52, 56
X	M. Fekry Ismail, Abdel Momen A. El-Khamry, Fekria S. Sayed, Samir A. Emara, "Reaction of 6,8-Dibromo-2-Phenyl-3,1-Benzoxazin-4-One with Hydrazines, Schiff Bases and Azines", Egyptian Journal of Chemistry, 1991, Vol. 32, No. 4, p. 433-444	1-7, 24, 25, 27 -30, 32, 34, 46 -52, 56
P, X	Manjusha Verma, Sundaram Singh, K. N. Singh, "SYNTHESIS OF SOME NEW BENZOXAZINE DERIVATIVES OF BIOLOGICAL INTEREST", Heterocyclic Communications, 2003, Vol. 9, No. 5, p. 499-502	1-8, 16, 24, 2 5, 27-30, 32, 3 4, 38, 46-52, 5 6, 57

法第8条第3項（PCT17条(2)(a)）の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 87-96 は、この国際調査機関が調査することを要しない対象に係るものである。  
つまり、  
請求の範囲87-96は、治療による人体の処置方法に該当し、PCT17条(2)  
(a)(i)及びPCT規則39.1(iv)の規定により、この国際調査機関が調査  
をすることを要しない対象に係るものである。
2. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしてい  
ない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に  
従って記載されていない。

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

ナトリウム依存性リン酸輸送体阻害作用を示し部分化学構造「C-N-ベンゼン環-CO-N」を有する化合物は公知である (Journal of Laboratory and Clinical Medicine, 1983, Vol. 101, No. 2, p. 308-316)。

とすると請求の範囲1等の各選択肢に同一の技術的特徴「C-N-環A-CO-N」を、同一の「特別な技術的特徴（先行技術に対して貢献を明示する技術的特徴）」ということはできない。

してみれば、請求の範囲 1 等には、同一の特別な技術的特徴を含む技術的な関係のない発明が択一的な形式で記載されているということになる。

1. ☒ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

## 追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。
- ☒ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。

## (国際調査の範囲について)

明細書には、「 $R^5$ がアルキル基、アルコキシ基等である化合物」や「 $R^6$ 、 $R^7$ がともに水素原子、アルキル基、アルケニル基、アリール基等である化合物」などの製造例、及びこれらの化合物がナトリウム依存性リン酸輸送体阻害作用を示すことを明らかにする試験結果は具体的に記載されていない。

そして、部分化学構造「 $C-N$ -ベンゼン環- $CO-N$ 」を有し、ナトリウム依存性リン酸輸送体阻害作用を示す化合物としては、Journal of Laboratory and Clinical Medicine, 1983, Vol. 101, No. 2, p. 308-316に記載のものが当業者に知られているだけであり、「 $R^5$ がアルキル基、アルコキシ基等である化合物」や「 $R^6$ 、 $R^7$ がともに水素原子、アルキル基、アルケニル基、アリール基等である化合物」などのナトリウム依存性リン酸輸送体阻害作用が、当業者の技術常識であるともいえない。

さらに、受容体と相互作用できる化合物は、通常特定の大きさ・化学構造、官能基、物性(極性、イオン性等の電気的性質、親水・疎水性等)を有するものに限られる。

とすると、「 $R^5$ がアルキル基、アルコキシ基等である化合物」や「 $R^6$ 、 $R^7$ がともに水素原子、アルキル基、アルケニル基、アリール基等である化合物」などが、実施例として具体的に記載されている化合物と同等のナトリウム依存性リン酸輸送体阻害作用を有しているとは推認できない。

してみれば、請求の範囲1等の全ての化合物が、明細書により十分な裏付けがされているということとはできない。

請求の範囲1等は、明細書により十分な裏付けがされていないので、請求の範囲1等に係る発明と先行技術との関連(進歩性)を判断することができない。

したがって、国際調査報告は、明細書により十分な裏付けがされている以下の(1a)、(1b)、(2)及び(3)の化合物、並びにそれを有効成分とする医薬等についてだけ作成した(実施例化合物の先行技術調査は全て行っている)。

(1a)  $Z$ が $-N=CR^6R^7$ であり、 $A$ が置換されていてもよい5～9員の不飽和の炭素環部分または5～9員の不飽和の複素環部分を表し、 $R^5$ が置換されていてもよいアリール基、複素環式基、シクロアルキル基であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の一方が水素原子、アルキル基であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の他方が置換されていてもよいアリール基、アリールアルケニル基、複素環式基であり、そして $R^{101}$ と $R^{102}$ が一緒になって $=O$ を表し、かつ $R^{103}$ および $R^{104}$ が水素原子であるもの

(1b)  $Z$ が $-N=CR^6R^7$ であり、 $A$ が置換されていてもよいベンゼン環またはチオフェン環であり、 $R^5$ が置換されていてもよいフェニル基であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の一方が水素原子であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の他方が置換されていてもよいフェニル基であり、そして $R^{101}$ と $R^{104}$ が一緒になって結合を表し、かつ $R^{102}$ と $R^{103}$ とが一緒になって結合を表すもの

(2)  $Z$ が $-NH-CR^6R^7R^{17}$ であり、 $A$ が置換されていてもよいベンゼン環またはチオフェン環であり、 $R^5$ が置換されていてもよいフェニル基またはピリジル基であり、 $R^{17}$ が水素原子であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の一方が水素原子であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の他方が置換されていてもよいフェニル基であり、そして $R^{101}$ と $R^{102}$ が一緒になって $=O$ を表し、かつ $R^{103}$ および $R^{104}$ が水素原子であるもの

(3)  $Z$ が $-O-CR^6R^7R^{17}$ であり、 $A$ 、 $R^5$ が置換されていてもよいフェニル基であり、 $R^{17}$ が水素原子であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の一方が水素原子であり、 $R^6$ 、 $R^7$ の他方が置換されていてもよいフェニル基であり、そして $R^{101}$ と $R^{102}$ が一緒になって $=O$ を表し、かつ $R^{103}$ および $R^{104}$ が水素原子であるもの



## (発明の属する分野の分類の続き)

A61K31/167, 31/341, 31/381, 31/40, 31/41, 31/415, 31/4196, 31/42, 31/4402, 31/4406, 31/4409, 31/443, 31/445, 31/4535, 31/4545, 31/455, 31/495, 31/496, 31/517, 31/519, 31/5375, A61P3/06, 3/10, 5/18, 5/20, 7/06, 9/04, 11/00, 13/12, 15/10, 17/04, 19/02, 19/08, 21/00, 25/02, 37/00, 43/00

## (調査を行った分野の続き)

A61K31/167, 31/341, 31/381, 31/40, 31/41, 31/415, 31/4196, 31/42, 31/4402, 31/4406, 31/4409, 31/443, 31/445, 31/4535, 31/4545, 31/455, 31/495, 31/496, 31/517, 31/519, 31/5375, A61P3/06, 3/10, 5/18, 5/20, 7/06, 9/04, 11/00, 13/12, 15/10, 17/04, 19/02, 19/08, 21/00, 25/02, 37/00, 43/00